

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

| | | | |
|---|--|--|--|
| (51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 413/10, A01N 43/72, C07D 498/10, 417/10, 261/04, 291/04, 273/00, 263/10, 261/20, 277/10, 277/34, 403/10, 419/10 // (C07D 498/10, 311:00, 261:00) | | A1 | (11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 98/31681 |
| | | | (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 23. Juli 1998 (23.07.98) |
| (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/00069 | | | |
| (22) Internationales Anmeldedatum: 8. Januar 1998 (08.01.98) | | | |
| (30) Prioritätsdaten: 197 01 446.1 17. Januar 1997 (17.01.97) DE | | | |
| (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK- TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE). | | | |
| (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). KARDORFF, Uwe [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falken- strasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). ENGEL, Stefan [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 13, D-65510 Idstein (DE). MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). WITSCHER, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). GÖTZ, Norbert [DE/DE]; Schöffersstrasse | | 25, D-67547 Worms (DE). GEBHARDT, Joachim [DE/DE]; Pegauer Strasse 51, D-67157 Wachenheim (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, D-67063 Ludwigshafen (DE). | |
| | | (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE). | |
| | | (81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, AZ, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, ID, IL, JP, KG, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, UA, US, UZ, VN, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). | |
| | | Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen. | |

(54) Title: 3-HETEROCYCLYL-SUBSTITUTED BENZOYL DERIVATIVES

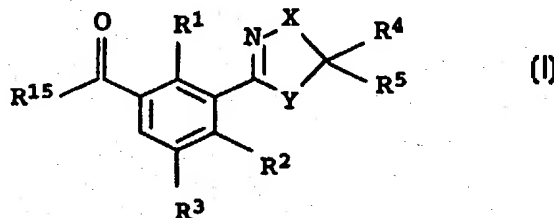
(54) Bezeichnung: 3-HETEROXYCYLYL-SUBSTITUIERTE BENZOYLDERIVATE

(57) Abstract

The invention concerns benzoyl derivatives of formula (I) in which the variables have the following meanings:

R¹, R²: hydrogen, nitro, halogen, cyano, alkyl, alkyl halide, alkoxy, alkoxy halide, alkylthio, alkylthio halide, alkylsulphinyl, alkylsulphinyl halide, alkylsulphonyl, or C₁-C₆ alkylsulphonyl halide; R³: hydrogen,

halogen or alkyl; R⁴, R⁵: hydrogen, halogen, cyano, nitro, alkyl, alkoxy, alkylthio, dialkylamino, phenyl or carbonyl, wherein the six last-mentioned groups can be substituted; X: O, S, NR⁹, CO or CR¹⁰R¹¹; Y: O, S, NR¹², CO or CR¹³R¹⁴; R¹⁵: optionally substituted pyrazole which is bonded in position 4 and carries a hydroxy or sulphonyloxy group in position 5. The invention also concerns: the salts of these 3-heterocyclyl-substituted benzoyl derivatives which can be used for agricultural purposes; processes and intermediate products for preparing these substances; agents containing them; and the use as herbicides of these derivatives or agents containing them.



(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft Benzoylderivate der Formel (I), in der die Variablen folgende Bedeutungen haben: R¹, R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylsulfinyl, Halogenalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl; R³ Wasserstoff, Halogen oder Alkyl; R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Dialkylamino, Phenyl oder Carbonyl, wobei die 6 letztgenannten Reste substituiert sein können; X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹; Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴; R¹⁵ gegebenenfalls substituiertes in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol, das in 5-Stellung einen Hydroxy- oder Sulfonyloxy-Rest trägt; sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate; Mittel, welche diese enthalten; sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltenden Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

| | | | | | | | |
|----|------------------------------|----|--------------------------------------|----|--|----|-----------------------------------|
| AL | Albanien | ES | Spanien | LS | Lesotho | SI | Slowenien |
| AM | Armenien | FI | Finnland | LT | Litauen | SK | Slowakei |
| AT | Österreich | FR | Frankreich | LU | Luxemburg | SN | Senegal |
| AU | Australien | GA | Gabun | LV | Lettland | SZ | Swasiland |
| AZ | Aserbaidshon | GB | Vereinigtes Königreich | MC | Monaco | TD | Tschad |
| BA | Bosnien-Herzegowina | GE | Georgien | MD | Republik Moldau | TG | Togo |
| BB | Barbados | GH | Ghana | MG | Madagaskar | TJ | Tadschikistan |
| BE | Belgien | GN | Guinea | MK | Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien | TM | Turkmenistan |
| BF | Burkina Faso | GR | Griechenland | ML | Mali | TR | Türkei |
| BG | Bulgarien | HU | Ungarn | MN | Mongolei | TT | Trinidad und Tobago |
| BJ | Benin | IE | Irland | MR | Mauretanien | UA | Ukraine |
| BR | Brasilien | IL | Israel | MW | Malawi | UG | Uganda |
| BY | Belarus | IS | Island | MX | Mexiko | US | Vereinigte Staaten von Amerika |
| CA | Kanada | IT | Italien | NE | Niger | UZ | Usbekistan |
| CF | Zentralafrikanische Republik | JP | Japan | NL | Niederlande | VN | Vietnam |
| CG | Kongo | KE | Kenia | NO | Norwegen | YU | Jugoslawien |
| CH | Schweiz | KG | Kirgisistan | NZ | Neuseeland | ZW | Zimbabwe |
| CI | Côte d'Ivoire | KP | Demokratische Volksrepublik Korea | PL | Polen | | |
| CM | Kamerun | KR | Republik Korea | PT | Portugal | | |
| CN | China | KZ | Kasachstan | RO | Rumänien | | |
| CU | Kuba | LC | St. Lucia | RU | Russische Föderation | | |
| CZ | Tschechische Republik | LI | Liechtenstein | SD | Sudan | | |
| DE | Deutschland | LK | Sri Lanka | SE | Schweden | | |
| DK | Dänemark | LR | Liberia | SG | Singapur | | |
| EE | Estland | | | | | | |

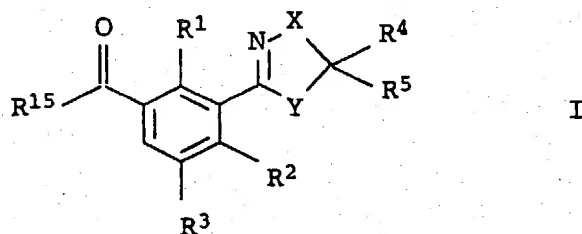
3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

10



15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

R¹, R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

20

R³ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

25

R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Hydroxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

30

35

40

oder

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls

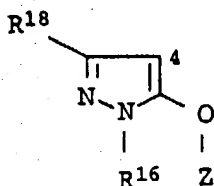
45

C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

- 5
R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;
- 10
R⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;
- R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 15 R⁸ C₁-C₄-Alkyl;
- X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;
- Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;
- 20 R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl oder CONR⁷R⁸;
- 25
oder
- R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
- 35
R¹⁵ ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II

40



II

45

wobei

R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl;

3

Z H oder SO_2R^{17} ;

R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Phenyl
 oder Phenyl, das partiell oder vollständig
 5 halogeniert ist und/oder eine bis drei der
 folgenden Gruppen trägt:
 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

10 R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl

bedeuten;

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel
 15 stehen;

und

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-
 20 methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-ben-
 zoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-
 4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-
 5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-
 25 methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und
 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-ben-
 zoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

30 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte
 zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche
 diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese
 enthaltende Mittel zur Schädnpflanzenbekämpfung.

35 Aus der Literatur, beispielsweise aus WO 96/26206 sind
 Pyrazol-4-yl-benzoylderivate bekannt.

Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen
 40 sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können
 jedoch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung
 die Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame,
 Verbindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

45 Demgemäß wurden die 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoylderivate
 der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I 5 gefunden.

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Er- 10 findung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des 15 Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

20

Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, 25 wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C_1 - C_4 -Alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxy- 30 eth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C_1 - C_4 -alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C_1 - C_4 -alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

35 Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C_1 - C_4 -Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und 40 Butyrat.

Die für die Substituenten R^1 - R^{18} oder als Reste an Phenylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. 45 Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Cyanoalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkyliminoxy-, Alkylcarbonyloxy, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-,

Halogenalkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkoxy-carbonyl-, Halogenalkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-, Alkinyloxy-, Dialkylamino-, Dialkylhydrazino-, Alkoxyalkyl-, Hydroxyalkoxyalkyl, Dialkoxyalkyl-, Alkylthioalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Dialkylhydrazinoalkyl-, Alkyliminooxyalkyl-, Alkoxy-carbonylalkyl- und Alkoxyalkoxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

10

Ferner bedeuten beispielsweise:

- C₁-C₄-Alkyl: sowie die Alkylteile von Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, 15 C₁-C₆-Alkyliminooxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl und C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- 20 - C₁-C₆-Alkyl: C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 25 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 30 - C₁-C₄-Halogenalkyl: einen C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor- 35 difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlor- 40 propyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluor-methyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brom-methyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl 45 und Nonafluorbutyl;

- C₁-C₆-Halogenalkyl: C₁-C₄-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 5 - C₁-C₄-Cyanoalkyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoeth-1-yl, 2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyanoprop-1-yl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobut-1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl, 4-Cyanobut-1-yl, 10 1-Cyanobut-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 1-Cyanobut-3-yl, 2-Cyanobut-3-yl, 1-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl und 2-Cyanomethyl-prop-2-yl;
- 15 - C₁-C₄-Alkoxy: sowie die Alkoxyteile von Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl und Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- 20 - C₁-C₆-Alkoxy: C₁-C₄-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 25 - C₁-C₄-Halogenalkoxy: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;
- 30 -
- 35 -
- 40 -
- 45 -

- 5 C₁-C₆-Halogenalkoxy: C₁-C₄-Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy und Dodecafluorhexoxy;
- 10 C₁-C₆-Alkyliminooxy: sowie die C₁-C₆-Alkyliminooxyteile von C₁-C₆-Alkyliminooxy-C₁-C₄-alkyl, z.B. Methyliminooxy, Ethyliminooxy, 1-Propyliminooxy, 2-Propyliminooxy, 1-Butyliminooxy, 2-Butyliminooxy, 2-Methyl-prop-1-yliminooxy, 1-Pentyliminooxy, 2-Pentyliminooxy, 3-Pentyliminooxy, 3-Methylbut-2-yliminooxy, 2-Methyl-but-1-yliminooxy, 3-Methylbut-1-yliminooxy, 1-Hexyliminooxy, 2-Hexyliminooxy, 3-Hexyliminooxy, 2-Methyl-pent-1-yliminooxy, 3-Methyl-pent-1-yliminooxy, 4-Methyl-pent-1-yliminooxy, 2-Ethyl-but-1-yliminooxy, 3-Ethyl-but-1-yliminooxy, 2,3-Dimethyl-but-1-yliminooxy, 3-Methyl-pent-2-yliminooxy, 4-Methyl-pent-2-yliminooxy und 3,3-Dimethyl-but-2-yliminooxy;
- 20 C₁-C₄-Alkylthio: z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;
- 25 C₁-C₆-Alkylthio: C₁-C₄-Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- 30
- 35 C₁-C₄-Halogenalkylthio: einen C₁-C₄-Alkylthiorest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlor-
- 40
- 45

propylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio und Nonafluorbutylthio;

- C₁-C₆-Halogenalkylthio: C₁-C₄-Halogenalkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio, 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluor-pentylthio, 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio, 6-Iodhexylthio und Dodecafluorhexylthio;

- C₁-C₆-Alkylsulfinyl (C₁-C₆-Alkyl-S(=O)-): z.B. Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylethylsulfinyl, Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl, 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;

- C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl: C₁-C₆-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl, 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl, 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl, 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl, Nonaflu-

orbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluor-pentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl, 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Dodecafluorhexyl-sulfinyl;

C₁-C₆-Alkylsulfonyl (C₁-C₆-Alkyl-S(=O)₂-): z.B. Methyl-sulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethyl-sulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methyl-propylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutyl-sulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropyl-sulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentyl-sulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethyl-propylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;

C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl: einen C₁-C₆-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethyl-sulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfo-nyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethyl-sulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl-sulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethyl-sulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropyl-sulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfo-nyl, Nonfluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlor-pentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl;

- C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl: z.B. Methoxy-carbonyl, Ethoxy-carbonyl, Propoxy-carbonyl, 1-Methylethoxy-carbonyl, Butoxy-carbonyl, 1-Methylpropoxy-carbonyl, 2-Methylpropoxy-carbonyl und 1,1-Dimethoxy-carbonyl;
- 5
- C₁-C₄-Halogenalkoxy-carbonyl: einen C₁-C₄-Alkoxy-carbonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy-carbonyl, Difluormethoxy-carbonyl, Trifluormethoxy-carbonyl, Chlordifluormethoxy-carbonyl, Bromdifluormethoxy-carbonyl, 2-Fluorethoxy-carbonyl, 2-Chlorethoxy-carbonyl, 2-Bromethoxy-carbonyl, 2-Iodethoxy-carbonyl, 2,2-Difluorethoxy-carbonyl, 2,2,2-Trifluorethoxy-carbonyl, 2-Chlor-2-fluorethoxy-carbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy-carbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy-carbonyl, 2,2,2-Trichlorethoxy-carbonyl, 15 Pentafluorethoxy-carbonyl, 2-Fluorpropoxy-carbonyl, 3-Fluorpropoxy-carbonyl, 2-Chlorpropoxy-carbonyl, 3-Chlorpropoxy-carbonyl, 2-Brompropoxy-carbonyl, 3-Brompropoxy-carbonyl, 2,2-Difluorpropoxy-carbonyl, 2,3-Difluorpropoxy-carbonyl, 20 2,3-Dichlorpropoxy-carbonyl, 3,3,3-Trifluorpropoxy-carbonyl, 3,3,3-Trichlorpropoxy-carbonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy-carbonyl, Heptafluorpropoxy-carbonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy-carbonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy-carbonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy-carbonyl, 4-Fluorbutoxy-carbonyl, 25 4-Chlorbutoxy-carbonyl, 4-Brombutoxy-carbonyl und 4-Iodbutoxy-carbonyl;
- C₃-C₆-Alkenyloxy: z.B. Prop-1-en-1-yloxy, Prop-2-en-1-yloxy, 1-Methylethenyloxy, Buten-1-yloxy, Buten-2-yloxy, Buten-3-yloxy, 30 1-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, Penten-1-yloxy, Penten-2-yloxy, Penten-3-yloxy, Penten-4-yloxy, 1-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 35 2-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yloxy, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yloxy, 40 Hex-1-en-1-yloxy, Hex-2-en-1-yloxy, Hex-3-en-1-yloxy, Hex-4-en-1-yloxy, Hex-5-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 2-Methyl-
- 45

pent-4-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yloxy und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yloxy;

- C₃-C₆-Alkinyloxy: z.B. Prop-1-in-1-yloxy, Prop-2-in-1-yloxy, But-1-in-1-yloxy, But-1-in-3-yloxy, But-1-in-4-yloxy, But-2-in-1-yloxy, Pent-1-in-1-yloxy, Pent-1-in-3-yloxy, Pent-1-in-4-yloxy, Pent-1-in-5-yloxy, Pent-2-in-1-yloxy, Pent-2-in-4-yloxy, Pent-2-in-5-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-3-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-4-yloxy, Hex-1-in-1-yloxy, Hex-1-in-3-yloxy, Hex-1-in-4-yloxy, Hex-1-in-5-yloxy, Hex-1-in-6-yloxy, Hex-2-in-1-yloxy, Hex-2-in-4-yloxy, Hex-2-in-5-yloxy, Hex-2-in-6-yloxy, Hex-3-in-1-yloxy, Hex-3-in-2-yloxy, 3-Methylpent-1-in-1-yloxy, 3-Methylpent-1-in-3-yloxy, 3-Methylpent-1-in-4-yloxy, 3-Methylpent-1-in-5-yloxy, 4-Methylpent-1-in-1-yloxy, 4-Methylpent-2-in-4-yloxy und 4-Methylpent-2-in-5-yloxy;

30 - Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino: z.B. N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, N,N-Dipropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino,

N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;

- 5
- [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1], sowie die Dialkylhydrazino-Teile von [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl: z.B. 2,2-Dimethylhydrazino-1, 2,2-Diethylhydrazino-1, 2,2-Dipropylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2,2-Dibutylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2,2-Di-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2,2-Di-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-propylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Methyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-methylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-propylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-ethylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-propylhydrazino-1, 2-Butyl-2-propylhydrazino-1, 2-(1-Methylpropyl)-2-propylhydrazino-1, 2-(2-Methylpropyl)-2-propylhydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-propylhydrazino-1, 2-Butyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylethyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methylpropyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1 und 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1;
- 35
- Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl: durch Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino wie voranstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. N,N-Dimethylaminomethyl, N,N-Diethylaminomethyl, N,N-Dipropylaminomethyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminomethyl, N,N-Dibutylaminomethyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminomethyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)aminomethyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-propylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminomethyl, N-Ethyl-N-propylaminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-ethylaminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-(1,1-di-
- 40
45

- methylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino-
methyl, N-Butyl-N-propylaminomethyl, N-(1-Methylpropyl)-N-
propylaminomethyl, N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl,
5 (1-methylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methyl-
propyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methyl-
propyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methyl-
ethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-Butyl-N-
10 (1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylpro-
pyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethyl-
ethyl)-N-(1-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethyl-
ethyl)-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, 2-(N,N-Dimethylamino)-
ethyl, 2-(N,N-Diethylamino)ethyl, 2-(N,N-Dipropylamino)-
15 ethyl, 2-[N,N-Di-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Dibutyl-
amino]ethyl, 2-[N,N-Di-(1-methylpropyl)amino]ethyl,
2-[N,N-Di-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Di-(1,1-
Dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-methylamino]ethyl,
2-[N-Methyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(1-methyl-
20 ethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-methylamino]ethyl, 2-[N-Me-
thyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(2-methyl-
propyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methyl-
amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Ethyl-
N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-ethylamino]ethyl,
25 2-[N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-
(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl-
amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylethyl)-N-propylamino]ethyl,
2-[N-Butyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-(1-Methylpropyl)-N-pro-
pylamino]ethyl, 2-[N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino]ethyl,
30 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino]ethyl,
2-[N-Butyl-N-(1-methyl-ethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
ethyl)-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
ethyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethyl-
ethyl)-N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(1-methyl-
35 propyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl,
2-[N-Butyl-N-(1,1-Dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
propyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethyl-
ethyl)-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethyl-
ethyl)-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 3-(N,N-Dimethyl-
40 amino)propyl, 3-(N,N-Diethylamino)propyl, 4-(N,N-Dimethyl-
amino)butyl und 4-(N,N-Diethylamino)butyl;
- C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend
genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methoxy-
45 methyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy)methyl,
Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methyl-
propoxy)methyl, (1,1-Dimethylethoxy)methyl, 2-(Methoxy)ethyl,

- 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;
- 20 - C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Propylthiomethyl, (1-Methylethylthio)methyl, Butylthiomethyl, (1-Methylpropylthio)methyl, (2-Methylpropylthio)methyl, (1,1-Dimethylethylthio)methyl, 2-Methylthioethyl, 2-Ethylthioethyl, 2-(Propylthio)ethyl, 2-(1-Methylethylthio)ethyl, 2-(Butylthio)ethyl, 2-(1-Methylpropylthio)ethyl, 2-(2-Methylpropylthio)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl, 2-(Methylthio)propyl, 3-(Methylthio)propyl, 2-(Ethylthio)propyl, 3-(Ethylthio)propyl, 3-(Propylthio)propyl, 3-(Butylthio)propyl, 4-(Methylthio)butyl, 4-(Ethylthio)butyl, 4-(Propylthio)butyl und 4-(Butylthio)butyl;
- 35 - C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, Propoxycarbonylmethyl, (1-Methylethoxycarbonyl)methyl, Butoxycarbonylmethyl, (1-Methylpropoxycarbonyl)methyl, (2-Methylpropoxycarbonyl)methyl, (1,1-Dimethylethoxycarbonyl)methyl, 2-(Methoxycarbonyl)ethyl, 2-(Ethoxycarbonyl)ethyl, 2-(Propoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethyl, 2-(Butoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)ethyl, 2-(Methoxycarbonyl)propyl, 2-(Ethoxycarbonyl)propyl, 2-(Propoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)propyl, 2-(Butoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methyl-

- propoxycarbonyl)propyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Methoxycarbonyl)propyl, 3-(Ethoxycarbonyl)propyl, 3-(Propoxycarbonyl)propyl, 3-(1-Methylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Butoxycarbonyl)propyl, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl, 2-(Methoxycarbonyl)butyl, 2-(Ethoxycarbonyl)butyl, 2-(Propoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl, 2-(Butoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl, 3-(Methoxycarbonyl)butyl, 3-(Ethoxycarbonyl)butyl, 3-(Propoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl, 3-(Butoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Methoxycarbonyl)butyl, 4-(Ethoxycarbonyl)butyl, 4-(Propoxycarbonyl)butyl, 4-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Butoxycarbonyl)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy und 4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl;
- C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy: durch C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiertes C₂-C₄-Alkoxy, also z.B. für 2-(Methoxy)ethoxy, 2-(Ethoxy)ethoxy, 2-(Propoxy)ethoxy, 2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(Butoxy)ethoxy, 2-(1-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethoxy, 2-(Methoxy)propoxy, 2-(Ethoxy)propoxy, 2-(Propoxy)propoxy, 2-(1-Methylethoxy)propoxy, 2-(Butoxy)propoxy, 2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methylpropoxy)propoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 3-(Methoxy)propoxy, 3-(Ethoxy)propoxy, 3-(Propoxy)propoxy, 3-(1-Methylethoxy)propoxy, 3-(Butoxy)propoxy, 3-(1-Methylpropoxy)propoxy, 3-(2-Methylpropoxy)propoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 2-(Methoxy)butoxy, 2-(Ethoxy)butoxy, 2-(Propoxy)butoxy, 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(Butoxy)butoxy, 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy, 3-(Ethoxy)butoxy, 3-(Propoxy)butoxy, 3-(1-Methylethoxy)butoxy, 3-(Butoxy)butoxy, 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methylpropoxy)butoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)butoxy, 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(Propoxy)butoxy, 4-(1-Methylethoxy)butoxy, 4-(Butoxy)butoxy, 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy;
- C₂-C₆-Alkandiyl: z.B. Ethan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Butan-1,4-diyl, Pentan-1,5-diyl und Hexan-1,6-diyl;

- C₃-C₈-Cycloalkyl: z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl;

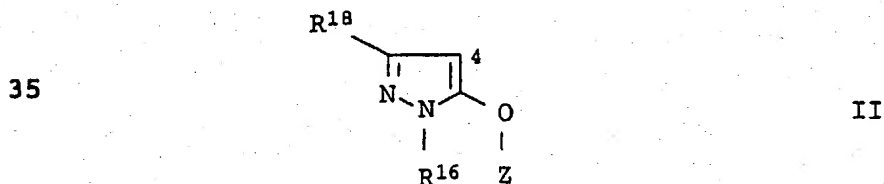
Alle Phenylringe sind vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, einen Cyano- und/oder einen oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-, Methoxy- oder Trifluormethoxysubstituenten.

Bevorzugt sind die 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoylderivate der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

- R¹, R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;
- R³ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;
- R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

- R^4 und R^5 bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;
- R^6 C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy,
 5 C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy,
 C_3 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Alkinyloxy oder NR^7R^8 ;
- R^7 Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;
- 10 R^8 C_1 - C_4 -Alkyl;
- X O, S, NR^9 , CO oder $CR^{10}R^{11}$;
- Y O, S, NR^{12} , CO oder $CR^{13}R^{14}$;
- 15 R^9 , R^{12} Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;
- R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl,
 C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy-carbonyl oder
 20 $CONR^7R^8$;
- oder
- R^4 und R^9 oder R^4 und R^{10} oder R^5 und R^{12} oder R^5 und R^{13} bilden
 25 gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyol-Kette, die ein- bis
 vierfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/
 oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
 C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein
 kann;
- 30 R^{15} ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II



- 40 wobei
- R^{16} C_1 - C_6 -Alkyl;
- Z H oder SO_2R^{17} ;

18

R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:

5 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl

10 bedeuten;

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel stehen;

15 und

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

25

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

In Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen
30 der Formel I als Herbizide haben die Variablen vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

R¹, R² Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

35 besonders bevorzugt Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio, wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder

40

45

C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;

- R³ Wasserstoff;
- 5 R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl,
- 10 C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
- 15 Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
- 20 C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- oder
- R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein
- 25 bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
- 30 besonders bevorzugt steht R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;
- besonders bevorzugt steht R⁵ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 35 oder
- besonders bevorzugt bilden R⁴ und R⁵ eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stick-
- 40 stoff unterbrochen sein kann;
- R⁶ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder NR⁷R⁸;
- R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 45 R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

20

- X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;
- Y O, S, NR¹² oder CR¹³R¹⁴;
- 5 R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;
- 10 oder
- R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
- 15
- 20 R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl; besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 2-Methyl-propyl oder Butyl;
- Z H oder SO₂R¹⁷;
- 25 R¹⁷ C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- 30 R¹⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.

35 Folgende Ausführungsformen der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I sind hervorzuheben:

1. In einer bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für SO₂R¹⁷.
- 40
- Besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

21

- Ebenso besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Methyl steht.
- 5 * Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht.
2. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für
10 Wasserstoff.
- Besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei X für Sauerstoff und Y für CR¹³R¹⁴ stehen.
15
- * Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei
- 20 R⁴ Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
25 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
30
- 35 R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
 oder
- 40 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
- 45 oder

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

5

bedeuten.

- Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

10

R⁴ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;

15

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

20

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

25

oder

R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

30

bedeuten.

35

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

40

- * Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei auch 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R⁴ und R⁵ für Wasserstoff stehen.

45

- Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

23

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

5 R¹ Nitro, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl wie z.B. Difluor-
10 methyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkyl-sulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, z.B. Trifluor-
methylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;
bedeutet.

15 Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

20 R² Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio wie z.B.
25 Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;
30

bedeuten.

35 Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt ist 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol.

40 Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, insbesondere die Alkalimetallsalze, wie z.B. Lithium, Natrium und Kalium, und die
45 Ammoniumsalze, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,

Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium.

- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Methyl steht.

Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

R¹ Nitro, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C₁-C₆-Halogenalkyl wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;

bedeutet.

Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

R² Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C₁-C₆-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C₁-C₆-Alkylthio wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;

bedeutet.

25

Ebenso besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

X für S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

5

oder

Y für O, S, NR¹² oder CO;

10

stehen.

* Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.

15

* Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R¹⁸ für C₁-C₆-Alkyl bedeutet.

20

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

25

R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

30

35

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

40

oder

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls

45

C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

5

10

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl-substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

bedeuten.

15

* Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

20

X für S, NR⁹ oder CO

oder

y für O, NR¹² oder CO

25

bedeutet.

30

• Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei

35

40

45

R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

27

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

5

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

10

oder

15

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl-substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

20

bedeuten.

25

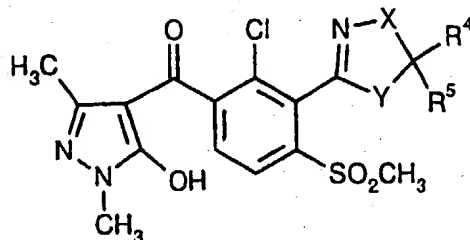
30

35

40

45

Insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ia1 (\cong I mit $R^1 = Cl$, $R^2 = SO_2CH_3$, $R^3 = H$, R^{16} , $R^{18} = CH_3$, $Z=H$), insbesondere die Verbindungen der Tabelle 1.



Ia1

Tabelle 1

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|-----------|--|-------------------------------|-----------------------------------|----|
| 15 Ia1.1 | CH ₂ | H | CH ₃ | O |
| Ia1.2 | CH ₂ | H | H | O |
| Ia1.3 | C(CH ₃) ₂ | H | H | O |
| Ia1.4 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.5 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | O |
| 20 Ia1.6 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | O |
| Ia1.7 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | O |
| Ia1.8 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | O |
| Ia1.9 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | O |
| Ia1.10 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.11 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | O |
| 25 Ia1.12 | C=O | CH ₃ | CH ₃ | O |
| Ia1.13 | C=O | H | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.14 | C=O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | O |
| Ia1.15 | C=O | H | H | O |
| Ia1.16 | C=O | H | CH ₃ | O |
| 30 Ia1.17 | CH ₂ | H | CH ₃ | S |
| Ia1.18 | C(CH ₃) ₂ | H | H | S |
| Ia1.19 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | S |
| Ia1.20 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | S |
| Ia1.21 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | S |
| 35 Ia1.22 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | S |
| Ia1.23 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | S |
| Ia1.24 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | S |
| Ia1.25 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | S |
| Ia1.26 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | S |
| 40 Ia1.27 | CH ₂ | H | CH ₃ | NH |
| Ia1.28 | CH ₂ | H | H | NH |
| Ia1.29 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NH |
| Ia1.30 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NH |
| Ia1.31 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| 45 Ia1.32 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NH |
| Ia1.33 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NH |
| Ia1.34 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NH |

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|-----------|--|------------------|----------------------------|-------------------------|
| 1a1.35 | $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_4-$ | | H | NH |
| 1a1.36 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | H | H | NH |
| 1a1.37 | CH_2 | H | $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ | NH |
| 5 1a1.38 | CH_2 | H | CH_3 | NCH_3 |
| 1a1.39 | CH_2 | H | H | NCH_3 |
| 1a1.40 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | H | H | NCH_3 |
| 1a1.41 | CH_2 | H | C_2H_5 | NCH_3 |
| 1a1.42 | CH_2 | CH_3 | CH_3 | NCH_3 |
| 10 1a1.43 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | H | CH_3 | NCH_3 |
| 1a1.44 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | H | CH_3 | NCH_3 |
| 1a1.45 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | H | H | NCH_3 |
| 1a1.46 | CH_2 | H | $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ | NCH_3 |
| 1a1.47 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | H | C_2H_5 | NCH_3 |
| 15 1a1.48 | $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_4-$ | | H | NCH_3 |
| 1a1.49 | CH_2 | H | CH_3 | NC_2H_5 |
| 1a1.50 | CH_2 | H | H | NC_2H_5 |
| 1a1.51 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | H | H | NC_2H_5 |
| 1a1.52 | CH_2 | H | C_2H_5 | NC_2H_5 |
| 20 1a1.53 | CH_2 | CH_3 | CH_3 | NC_2H_5 |
| 1a1.54 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | H | CH_3 | NC_2H_5 |
| 1a1.55 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | H | CH_3 | NC_2H_5 |
| 1a1.56 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | H | H | NC_2H_5 |
| 1a1.57 | CH_2 | H | $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ | NC_2H_5 |
| 25 1a1.58 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | H | C_2H_5 | NC_2H_5 |
| 1a1.59 | $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_4-$ | | H | NC_2H_5 |
| 1a1.60 | CH_2 | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.61 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.62 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | S |
| 30 1a1.63 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.64 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.65 | $\text{CCH}_3(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.66 | $\text{CCH}_3[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | S |
| 1a1.67 | CH_2 | | $=\text{O}$ | NH |
| 35 1a1.68 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 1a1.69 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 1a1.70 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 1a1.71 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 1a1.72 | $\text{CCH}_3(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 40 1a1.73 | $\text{CCH}_3[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | NH |
| 1a1.74 | CH_2 | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.75 | $\text{CH}(\text{CH}_3)$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.76 | $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.77 | $\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 45 1a1.78 | $\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.79 | $\text{CCH}_3(\text{C}_2\text{H}_5)$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.80 | $\text{CCH}_3[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]$ | | $=\text{O}$ | NCH_3 |
| 1a1.81 | O | COOCH_3 | H | CH_2 |

| | Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|---------|------------------------------------|---|---------------------------------------|--------------------------------|
| 5 | Ia1.82 | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| | Ia1.83 | O | CONHCH ₃ | H | CH ₂ |
| | Ia1.84 | O | CON(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.85 | O | CONHC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| | Ia1.86 | O | CON(C ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| 10 | Ia1.87 | O | CH ₃ | H | CH ₂ |
| | Ia1.88 | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| | Ia1.89 | O | CH(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.90 | O | COC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| | Ia1.91 | O | CH ₂ CN | H | CH ₂ |
| 15 | Ia1.92 | O | CH ₂ N(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.93 | O | CH ₂ ON=C(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.94 | O | CH(OC ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.95 | O | CH(OCH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| | Ia1.96 | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ |
| 20 | Ia1.97 | O | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| | Ia1.98 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| | Ia1.99 | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ |
| | Ia1.100 | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ |
| | Ia1.101 | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | |
| 25 | Ia1.102 | O | H | -(CH ₂) ₄ -CH- | |
| | Ia1.103 | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ |
| | Ia1.104 | S | | =O | O |
| | Ia1.105 | CH ₂ | | =S | S |
| | Ia1.106 | CH(CH ₃) | | =S | S |
| 30 | Ia1.107 | CH(C ₂ H ₅) | | =S | S |
| | Ia1.108 | C(CH ₃) ₂ | | =S | S |
| | Ia1.109 | O | | =O | NH |
| | Ia1.110 | O | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.111 | O | CH ₃ | H | NH |
| 35 | Ia1.112 | O | C ₂ H ₅ | H | NH |
| | Ia1.113 | O | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| | Ia1.114 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NH |
| | Ia1.115 | O | CH ₃ | H | NCH ₃ |
| | Ia1.116 | O | C ₂ H ₅ | H | NCH ₃ |
| 40 | Ia1.117 | O | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ia1.118 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | Ia1.119 | NH | | =O | NH |
| | Ia1.120 | NH | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.121 | NCH ₃ | | =O | NH |
| | Ia1.122 | NCH ₃ | | =O | NCH ₃ |
| | Ia1.123 | NC ₂ H ₅ | | =O | NH |
| | Ia1.124 | NC ₂ H ₅ | | =O | NC ₂ H ₅ |

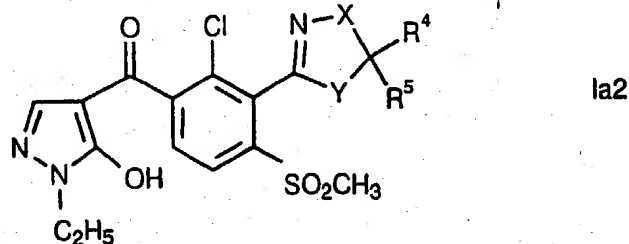
45

Desweiteren sind folgende Benzoylderivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

- die Verbindungen Ia2.1-Ia2.124, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia1.1-Ia1.124 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

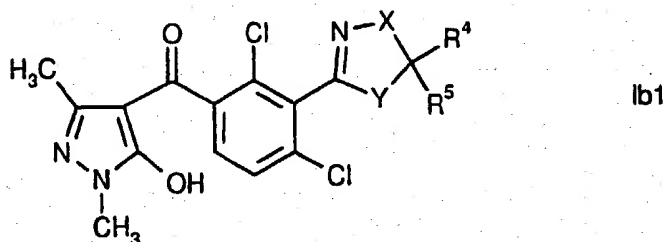
5

10



Ebenso insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ib1 (\cong I mit R¹, R² = Cl, R³ = H, R¹⁶, R¹⁸ = CH₃, Z = H) insbesondere die Verbindungen der Tabelle 2

20



25 Tabelle 2

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | |
|-----|--------|--|-------------------------------|-----------------------------------|---|
| 30 | Ib1.1 | CH ₂ | H | CH ₃ | O |
| | Ib1.2 | CH ₂ | H | H | O |
| | Ib1.3 | C(CH ₃) ₂ | H | H | O |
| | Ib1.4 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | O |
| | Ib1.5 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | O |
| | Ib1.6 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | O |
| | Ib1.7 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | O |
| | Ib1.8 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | O |
| 35 | Ib1.9 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | O |
| | Ib1.10 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | O |
| | Ib1.11 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | O |
| 40 | Ib1.12 | C=O | CH ₃ | CH ₃ | O |
| | Ib1.13 | C=O | H | C ₂ H ₅ | O |
| | Ib1.14 | C=O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | O |
| | Ib1.15 | C=O | H | H | O |
| | Ib1.16 | C=O | H | CH ₃ | O |
| | Ib1.17 | CH ₂ | H | CH ₃ | S |
| | Ib1.18 | CH ₂ | H | H | S |
| | Ib1.19 | C(CH ₃) ₂ | H | H | S |
| 45 | Ib1.20 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | S |
| | Ib1.21 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | S |
| | Ib1.22 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | S |
| | Ib1.23 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | S |

| | Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|--------|---|-----------------|-----------------------------------|--------------------------------|
| | Ib1.24 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | S |
| | Ib1.25 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | S |
| | Ib1.26 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | S |
| 5 | Ib1.27 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | S |
| | Ib1.28 | CH ₂ | H | CH ₃ | NH |
| | Ib1.29 | CH ₂ | H | H | NH |
| | Ib1.30 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NH |
| | Ib1.31 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NH |
| | Ib1.32 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| 10 | Ib1.33 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NH |
| | Ib1.34 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NH |
| | Ib1.35 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NH |
| | Ib1.36 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NH |
| | Ib1.37 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NH |
| | Ib1.38 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NH |
| 15 | Ib1.39 | CH ₂ | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ib1.40 | CH ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | Ib1.41 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NCH ₃ |
| | Ib1.42 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | Ib1.43 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ib1.44 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| 20 | Ib1.45 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NCH ₃ |
| | Ib1.46 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NCH ₃ |
| | Ib1.47 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NCH ₃ |
| | Ib1.48 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| | Ib1.49 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NCH ₃ |
| | Ib1.50 | CH ₂ | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| 25 | Ib1.51 | CH ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.52 | C(CH ₃) ₂ | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.53 | CH ₂ | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.54 | CH ₂ | CH ₃ | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.55 | CH(CH ₃) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.56 | CH(C ₂ H ₅) | H | CH ₃ | NC ₂ H ₅ |
| 30 | Ib1.57 | CH[CH(CH ₃) ₂] | H | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.58 | CH ₂ | H | CH(CH ₃) ₂ | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.59 | CH(C ₂ H ₅) | H | C ₂ H ₅ | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.60 | -CH-(CH ₂) ₄ - | | H | NC ₂ H ₅ |
| | Ib1.61 | CH ₂ | | =O | S |
| | Ib1.62 | CH(CH ₃) | | =O | S |
| 35 | Ib1.63 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | S |
| | Ib1.64 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| | Ib1.65 | C(CH ₃) ₂ | | =O | S |
| | Ib1.66 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | S |
| | Ib1.67 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | S |
| | Ib1.68 | CH ₂ | | =O | NH |
| 40 | Ib1.69 | CH(CH ₃) | | =O | NH |
| | Ib1.70 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| | Ib1.71 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| | Ib1.72 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NH |
| | Ib1.73 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | NH |
| | Ib1.74 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | NH |
| 45 | Ib1.75 | CH ₂ | | =O | NCH ₃ |
| | Ib1.76 | CH(CH ₃) | | =O | NCH ₃ |
| | Ib1.77 | CH(C ₂ H ₅) | | =O | NCH ₃ |

| Nr. | X | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|------------|---|---|---|--------------------------------|
| 161.78 | CH[CH(CH ₃) ₂] | | =O | NCH ₃ |
| 161.79 | C(CH ₃) ₂ | | =O | NCH ₃ |
| 161.80 | CCH ₃ (C ₂ H ₅) | | =O | NCH ₃ |
| 5 161.81 | CCH ₃ [CH(CH ₃) ₂] | | =O | NCH ₃ |
| 161.82 | O | COOCH ₃ | H | CH ₂ |
| 161.83 | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 161.84 | O | CONHCH ₃ | H | CH ₂ |
| 161.85 | O | CON(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.86 | O | CONHC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 10 161.87 | O | CON(C ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.88 | O | CH ₃ | H | CH ₂ |
| 161.89 | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 161.90 | O | CH(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.91 | O | COC ₂ H ₅ | H | CH ₂ |
| 161.92 | O | CH ₂ CN | H | CH ₂ |
| 15 161.93 | O | CH ₂ N(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.94 | O | CH ₂ ON=C(CH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.95 | O | CH(OC ₂ H ₅) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.96 | O | CH(OCH ₃) ₂ | H | CH ₂ |
| 161.97 | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ |
| 161.98 | O | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| 20 161.99 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ |
| 161.100 | O | | -(CH ₂) ₄ - | CH ₂ |
| 161.101 | O | | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | CH ₂ |
| 161.102 | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | |
| 161.103 | O | H | -(CH ₂) ₄ -CH- | |
| 161.104 | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ |
| 25 161.105 | O | H | H | CH ₂ |
| 161.106 | S | | =O | O |
| 161.107 | CH ₂ | | =S | S |
| 161.108 | CH(CH ₃) | | =S | S |
| 161.109 | CH(C ₂ H ₅) | | =S | S |
| 161.110 | C(CH ₃) ₂ | | =S | S |
| 30 161.111 | O | | =O | NH |
| 161.112 | O | | =O | NCH ₃ |
| 161.113 | O | CH ₃ | H | NH |
| 161.114 | O | C ₂ H ₅ | H | NH |
| 161.115 | O | CH ₃ | CH ₃ | NH |
| 161.116 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NH |
| 35 161.117 | O | CH ₃ | H | NCH ₃ |
| 161.118 | O | C ₂ H ₅ | H | NCH ₃ |
| 161.119 | O | CH ₃ | CH ₃ | NCH ₃ |
| 161.120 | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | NCH ₃ |
| 161.121 | NH | | =O | NH |
| 161.122 | NH | | =O | NCH ₃ |
| 40 161.123 | NCH ₃ | | =O | NH |
| 161.124 | NCH ₃ | | =O | NCH ₃ |
| 161.125 | NC ₂ H ₅ | | =O | NH |
| 161.126 | NC ₂ H ₅ | | =O | NC ₂ H ₅ |

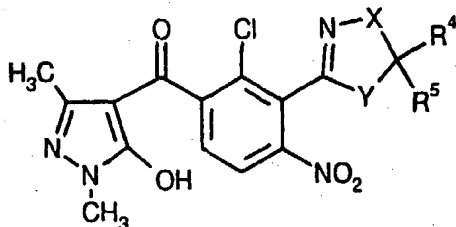
45 Desweiteren sind folgende 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoyl-derivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

- die Verbindungen Ib2.1-Ib2.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro steht.

5

Ib2

10

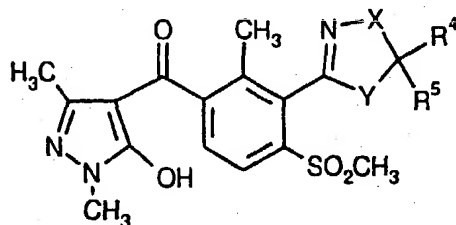


- die Verbindungen Ib3.1-Ib3.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl und R² für Methylsulfonyl stehen.

15

Ib3

20

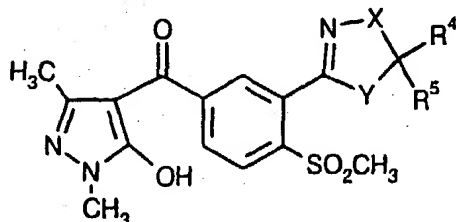


- die Verbindungen Ib4.1-Ib4.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff und R² für Methylsulfonyl stehen.

25

Ib4

30

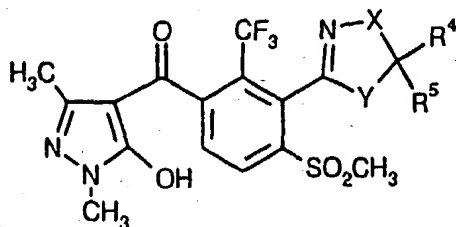


- die Verbindungen Ib5.1-Ib5.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl und R² für Methylsulfonyl stehen.

35

Ib5

40

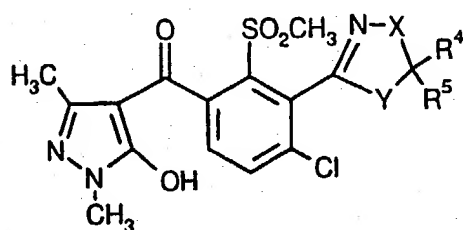


45

35

- die Verbindungen Ib6.1-Ib6.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl steht.

5

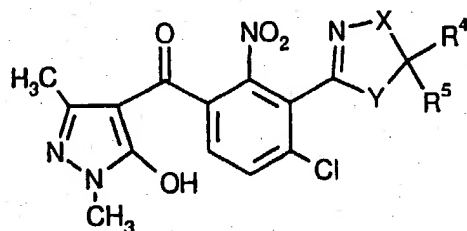


Ib6

10

- die Verbindungen Ib7.1-Ib7.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro steht.

15

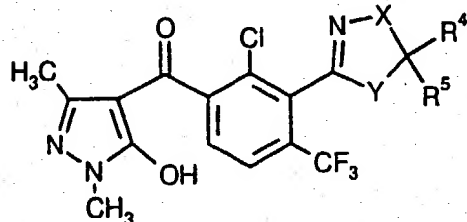


Ib7

20

- die Verbindungen Ib8.1-Ib8.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl steht.

25

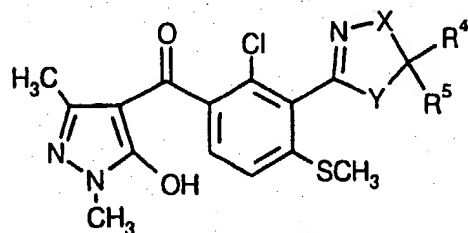


Ib8

30

- die Verbindungen Ib9.1-Ib9.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio steht.

35



Ib9

40

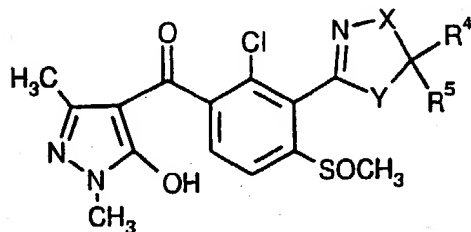
45

- die Verbindungen Ib10.1-Ib10.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfinyl steht.

5

Ib10

10

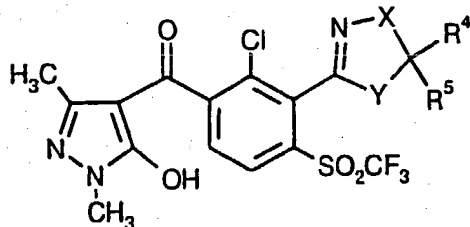


- die Verbindungen Ib11.1-Ib11.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethylsulfonyl steht.

15

Ib11

20

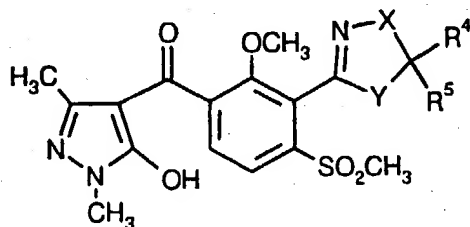


- die Verbindungen Ib12.1-Ib12.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy und R² für Methylsulfonyl stehen.

25

Ib12

30

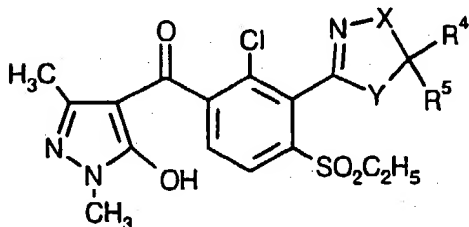


- die Verbindungen Ib13.1-Ib13.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl steht.

35

Ib13

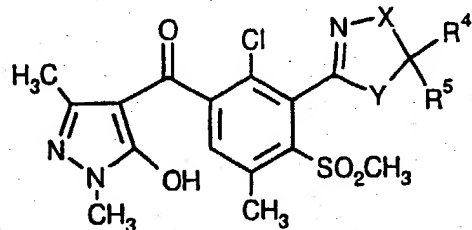
40



45

- die Verbindungen Ib14.1-Ib14.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und R³ für Methyl stehen.

5

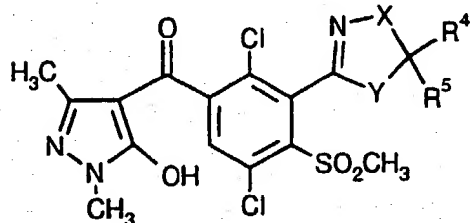


Ib14

10

- die Verbindungen Ib15.1-Ib15.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl und R³ für Chlor stehen.

15

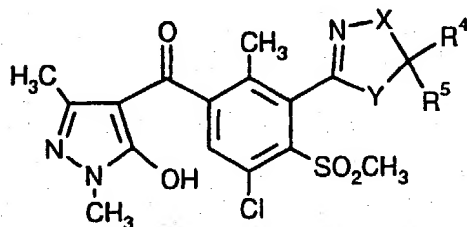


Ib15

20

- die Verbindungen Ib16.1-Ib16.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl und R³ für Chlor stehen.

25

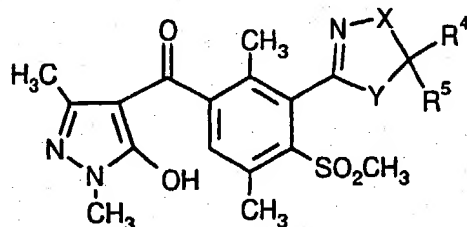


Ib16

30

- die Verbindungen Ib17.1-Ib17.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl und R³ für Methyl stehen.

35



Ib17

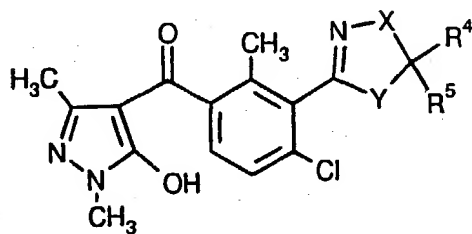
40

45

38

- die Verbindungen Ib18.1-Ib18.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl steht.

5

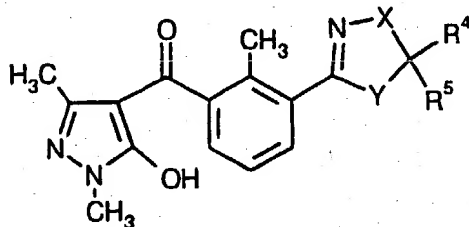


Ib18

10

- die Verbindungen Ib19.1-Ib19.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl und R^2 für Wasserstoff stehen.

15

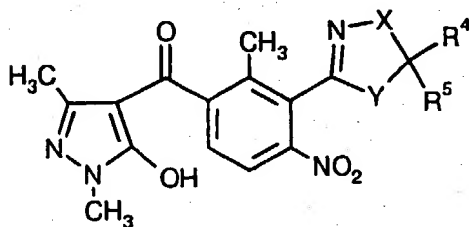


Ib19

20

- die Verbindungen Ib20.1-Ib20.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl und R^2 für Nitro stehen.

25

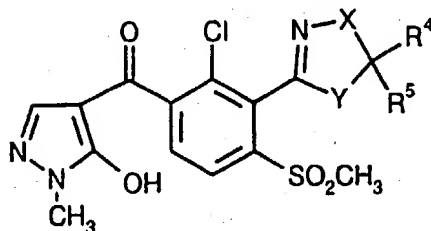


Ib20

30

- die Verbindungen Ib21.1-Ib21.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib21

40

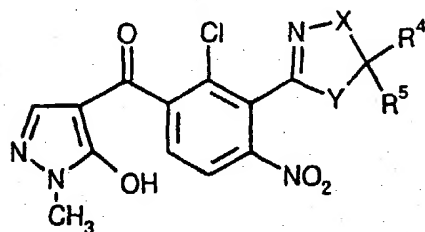
45

- die Verbindungen Ib22.1-Ib22.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib22

10

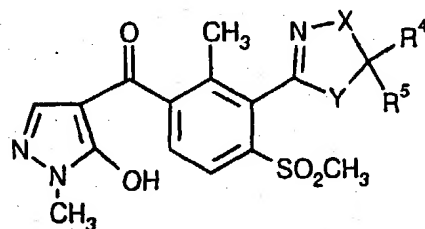


- die Verbindungen Ib23.1-Ib23.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib23

20

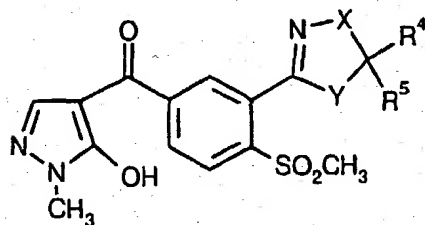


25

- die Verbindungen Ib24.1-Ib24.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib24



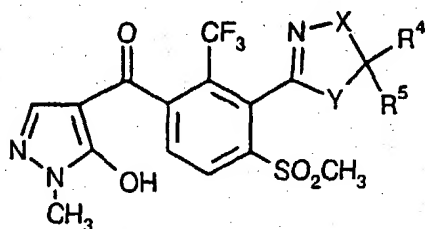
35

- die Verbindungen Ib25.1-Ib25.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

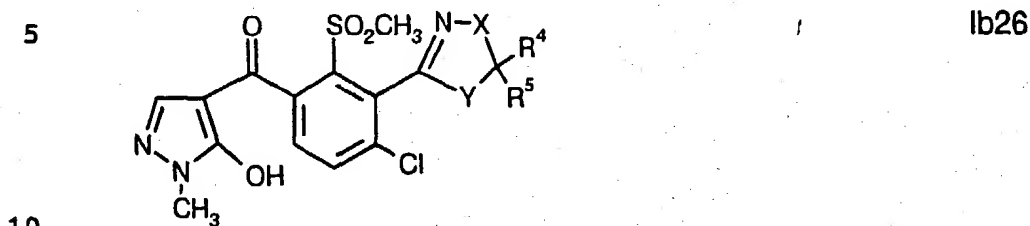
40

Ib25

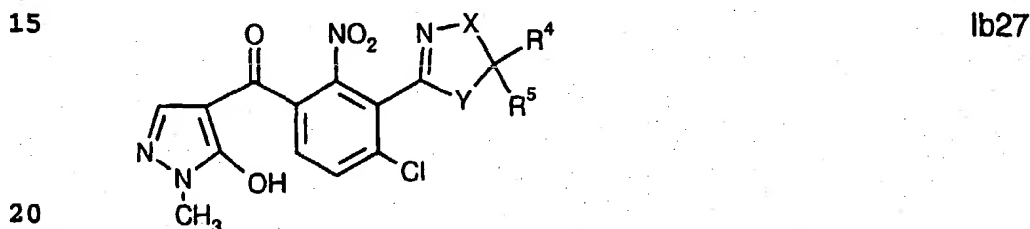
45



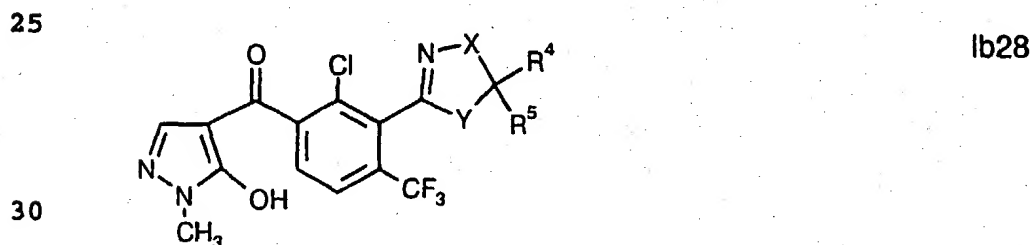
- die Verbindungen Ib26.1-Ib26.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



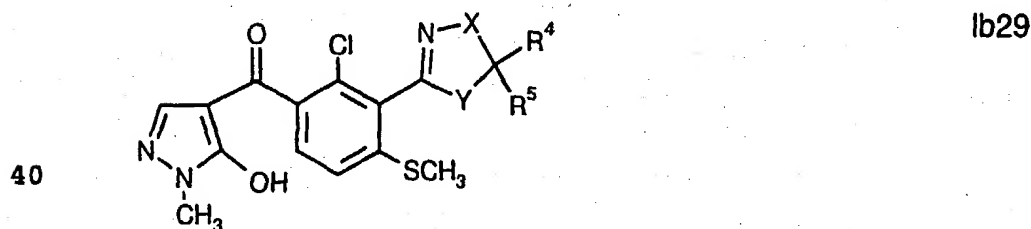
- die Verbindungen Ib27.1-Ib27.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- die Verbindungen Ib28.1-Ib28.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

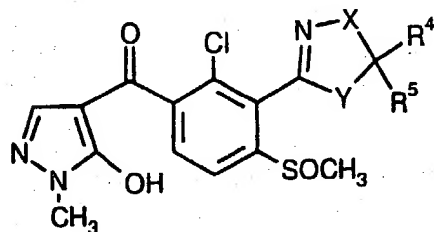


- die Verbindungen Ib29.1-Ib29.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylthio und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- die Verbindungen Ib30.1-Ib30.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

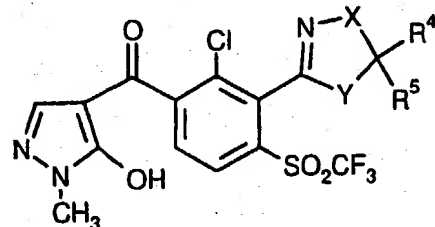


Ib30

10

- die Verbindungen Ib31.1-Ib31.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

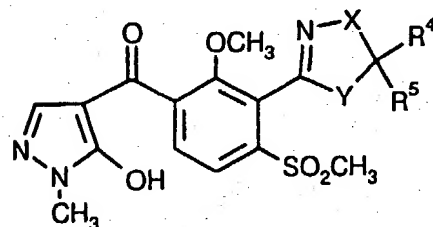


Ib31

20

- die Verbindungen Ib32.1-Ib32.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

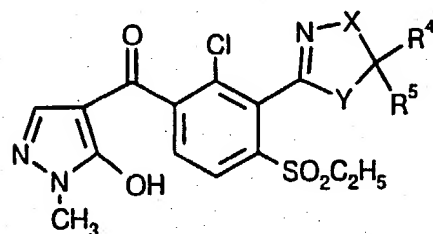


Ib32

30

- die Verbindungen Ib33.1-Ib33.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib33

40

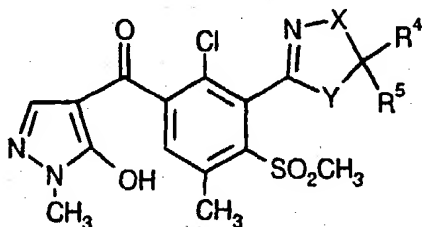
45

- die Verbindungen Ib34.1-Ib34.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib34

10

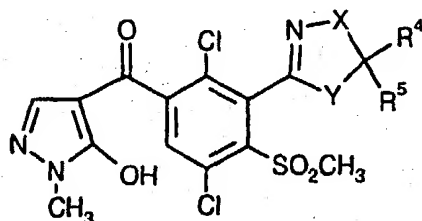


- die Verbindungen Ib35.1-Ib35.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib35

20

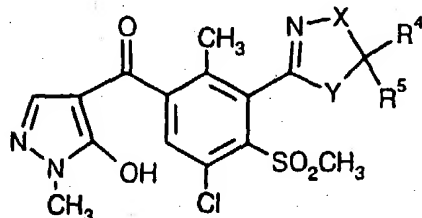


25

- die Verbindungen Ib36.1-Ib36.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib36



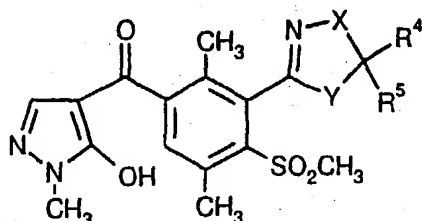
35

- die Verbindungen Ib37.1-Ib37.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

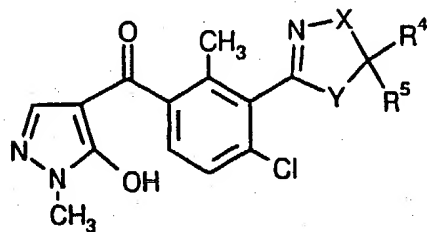
Ib37

45



- die Verbindungen Ib38.1-Ib38.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

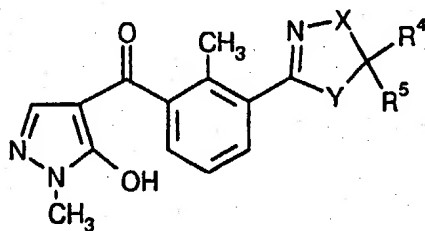


Ib38

10

- die Verbindungen Ib39.1-Ib39.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

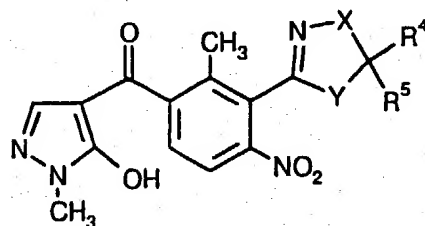


Ib39

20

- die Verbindungen Ib40.1-Ib40.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

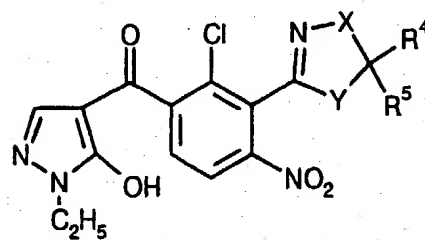


Ib40

30

- die Verbindungen Ib41.1-Ib41.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib41

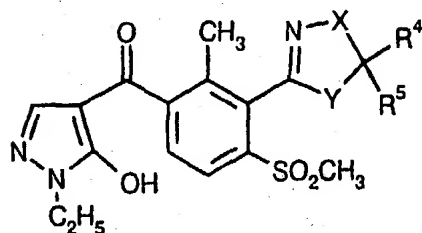
40

45

- die Verbindungen Ib42.1-Ib42.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

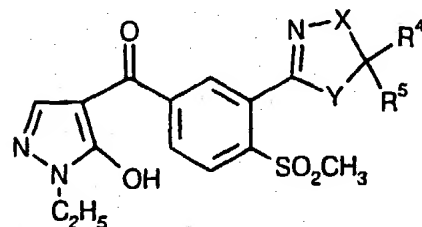


Ib42

15

- die Verbindungen Ib43.1-Ib43.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

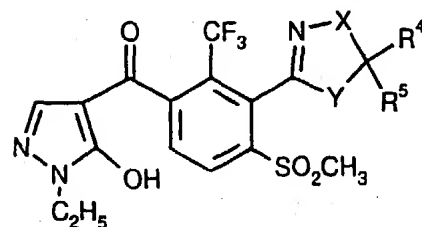


Ib43

25

- die Verbindungen Ib44.1-Ib44.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

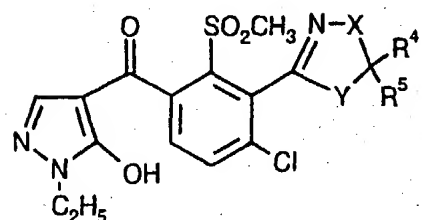


Ib44

35

- die Verbindungen Ib45.1-Ib45.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

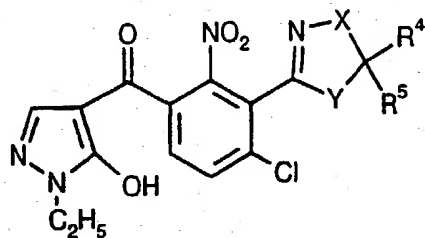


Ib45

45

- die Verbindungen Ib46.1-Ib46.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

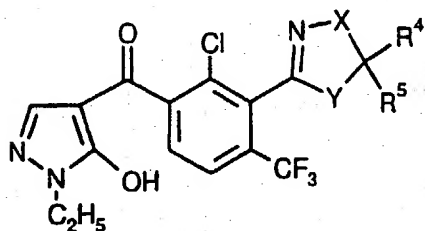


Ib46

10

- die Verbindungen Ib47.1-Ib47.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

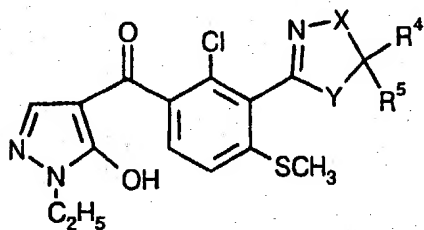


Ib47

20

- die Verbindungen Ib48.1-Ib48.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

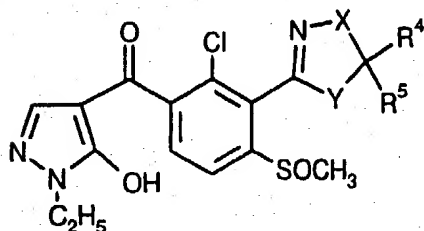


Ib48

30

- die Verbindungen Ib49.1-Ib49.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib49

40

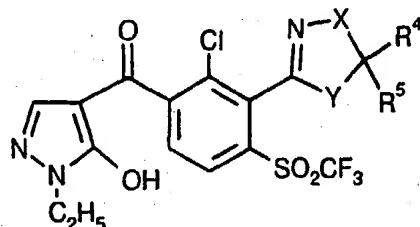
45

46

- die Verbindungen Ib50.1-Ib50.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

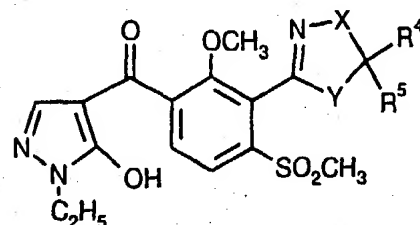


Ib50

15

- die Verbindungen Ib51.1-Ib51.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

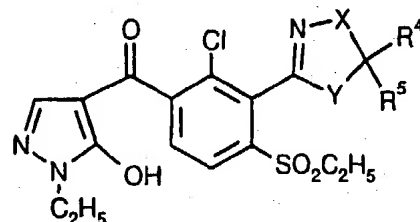


Ib51

25

- die Verbindungen Ib52.1-Ib52.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30



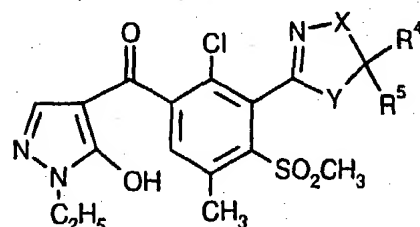
Ib52

35

- die Verbindungen Ib53.1-Ib53.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

45



Ib53

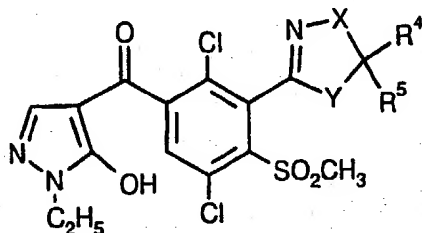
47

- die Verbindungen Ib54.1-Ib54.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib54

10

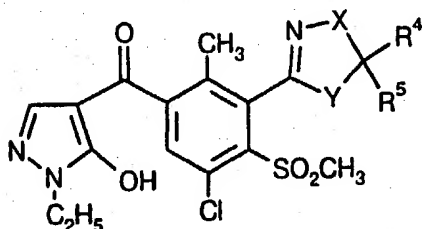


15

- die Verbindungen Ib55.1-Ib55.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib55

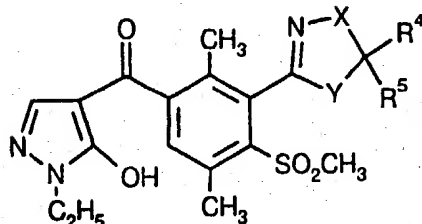


25

- die Verbindungen Ib56.1-Ib56.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib56

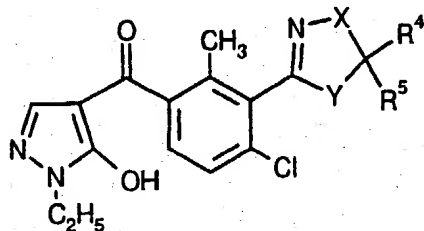


35

- die Verbindungen Ib57.1-Ib57.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib57



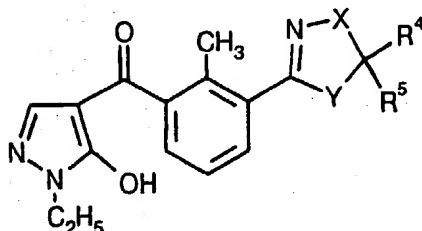
45

- die Verbindungen Ib58.1-Ib58.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib58

10

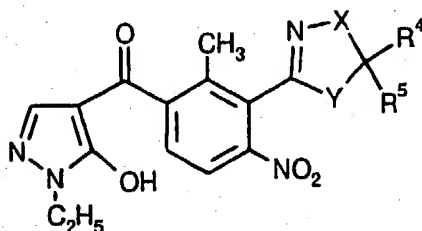


15

- die Verbindungen Ib59.1-Ib59.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib59

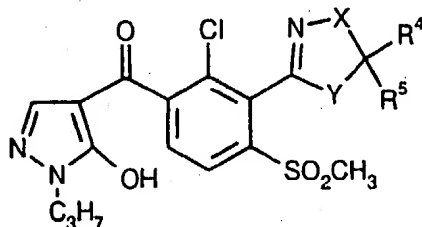


25

- die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib60

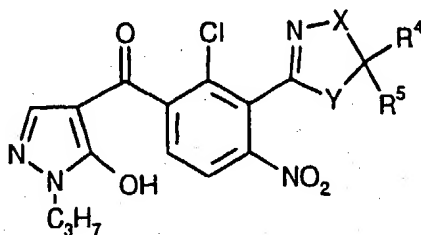


35

- die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib61

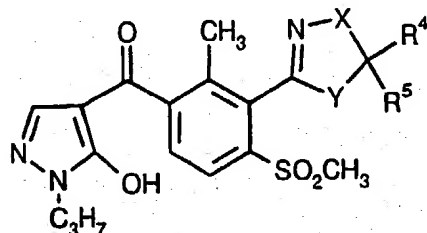


45

- die Verbindungen Ib62.1-Ib62.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

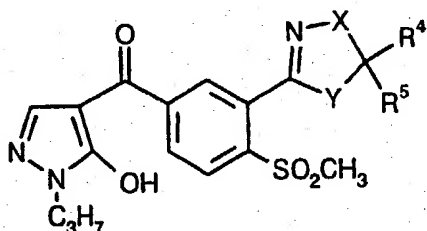


Ib62

15

- die Verbindungen Ib63.1-Ib63.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

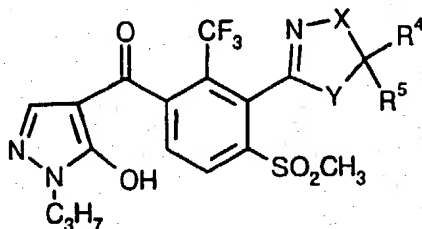


Ib63

25

- die Verbindungen Ib64.1-Ib64.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30



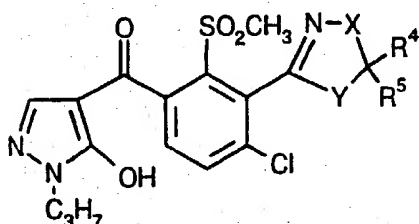
Ib64

35

- die Verbindungen Ib65.1-Ib65.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

45

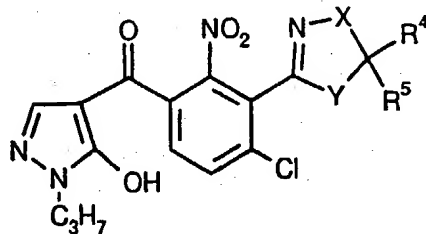


Ib65

50

- die Verbindungen Ib66.1-Ib66.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

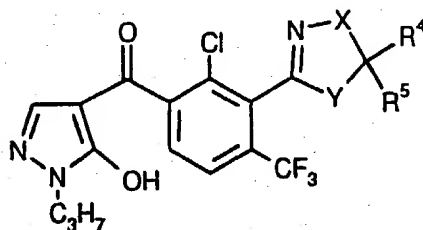


Ib66

10

- die Verbindungen Ib67.1-Ib67.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

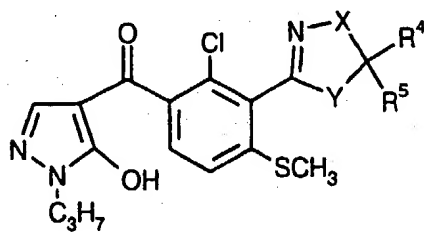


Ib67

20

- die Verbindungen Ib68.1-Ib68.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

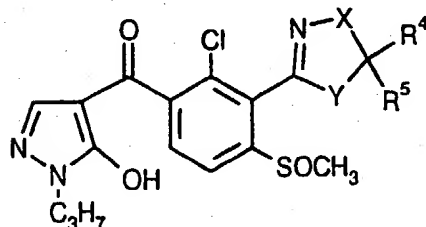


Ib68

30

- 35 - die Verbindungen Ib69.1-Ib69.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40



Ib69

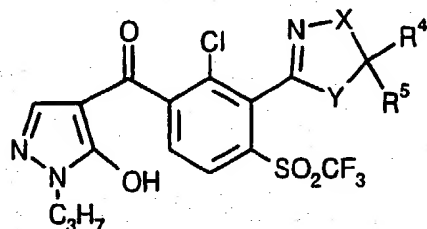
45

51

- die Verbindungen Ib70.1-Ib70.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

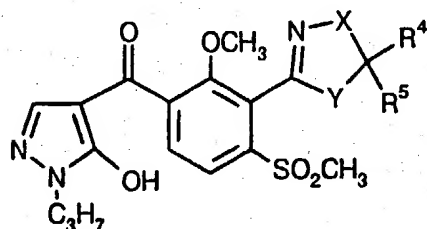


Ib70

15

- die Verbindungen Ib71.1-Ib71.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20



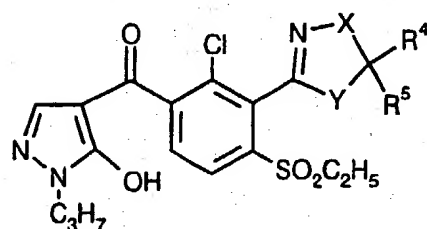
Ib71

25

- die Verbindungen Ib72.1-Ib72.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

35

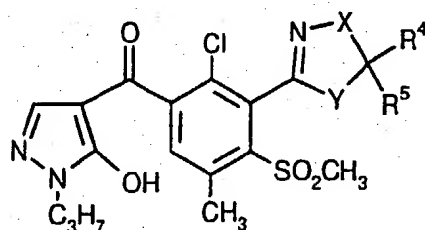


Ib72

40

- die Verbindungen Ib73.1-Ib73.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45



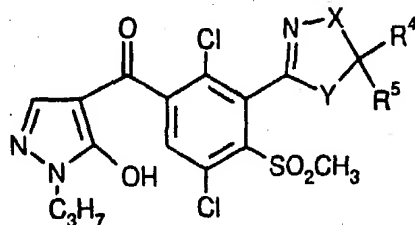
Ib73

- die Verbindungen Ib74.1-Ib74.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib74

10

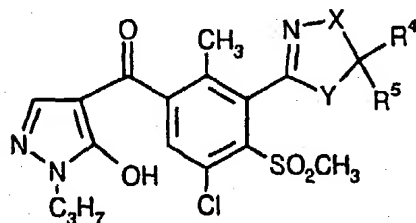


15

- die Verbindungen Ib75.1-Ib75.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib75

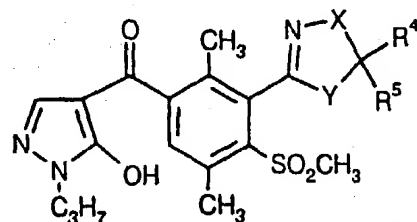


25

- die Verbindungen Ib76.1-Ib76.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib76



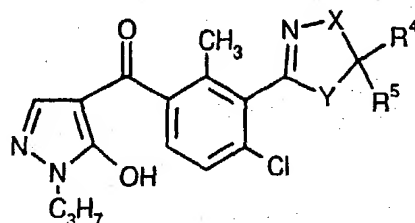
35

- die Verbindungen Ib77.1-Ib77.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib77

45



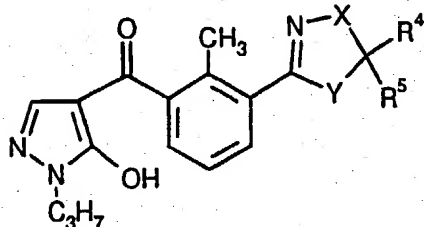
53

- die Verbindungen Ib78.1-Ib78.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib78

10

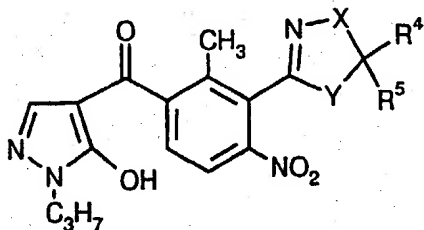


15

- die Verbindungen Ib79.1-Ib79.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib79

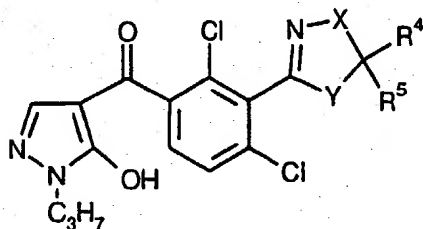


25

- die Verbindungen Ib80.1-Ib80.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib80

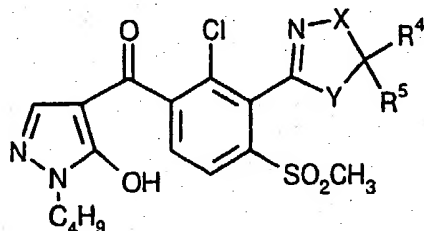


35

- die Verbindungen Ib81.1-Ib81.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib81



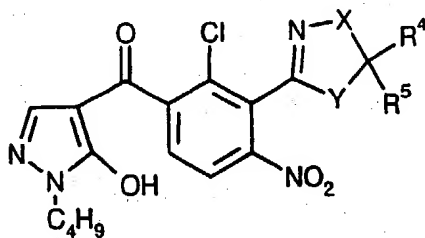
45

- die Verbindungen Ib82.1-Ib82.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib82

10

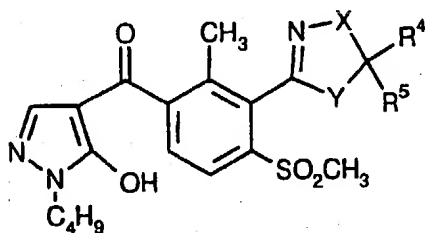


- die Verbindungen Ib83.1-Ib83.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib83

20

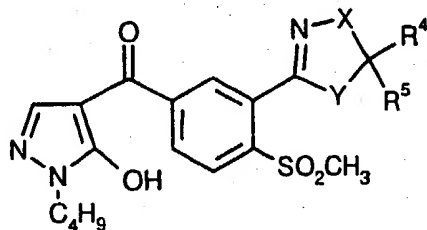


- die Verbindungen Ib84.1-Ib84.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib84

30

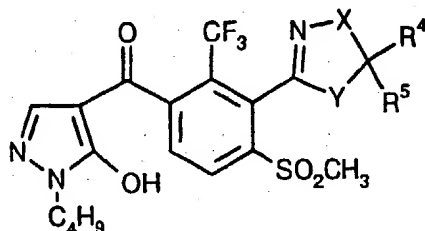


- die Verbindungen Ib85.1-Ib85.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib85

40



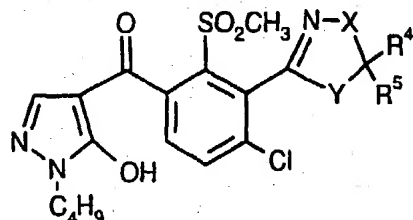
45

- die Verbindungen Ib86.1-Ib86.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib86

10

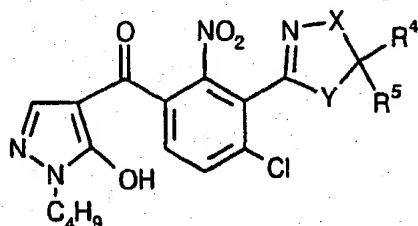


15

- die Verbindungen Ib87.1-Ib87.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib87

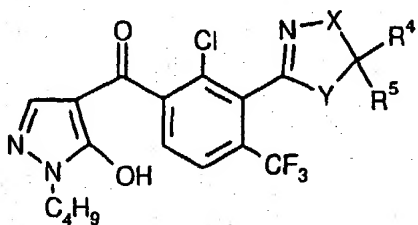


25

- die Verbindungen Ib88.1-Ib88.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib88

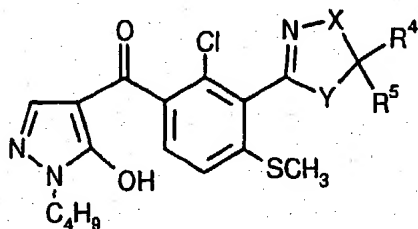


35

- die Verbindungen Ib89.1-Ib89.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib89



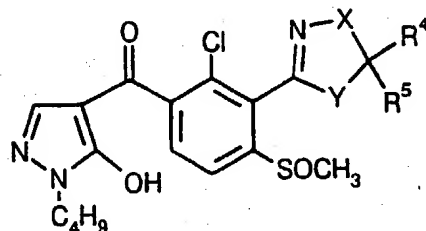
45

- die Verbindungen Ib90.1-Ib90.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib90

10

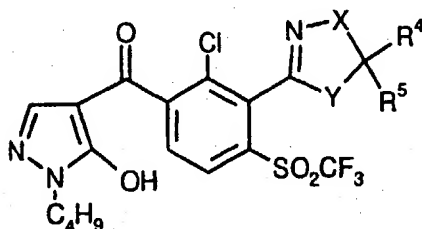


- die Verbindungen Ib91.1-Ib91.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib91

20

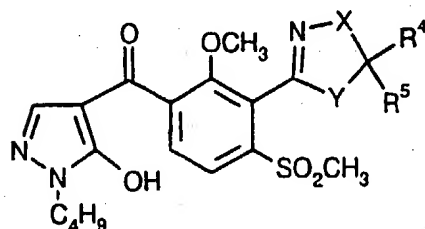


25

- die Verbindungen Ib92.1-Ib92.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib92



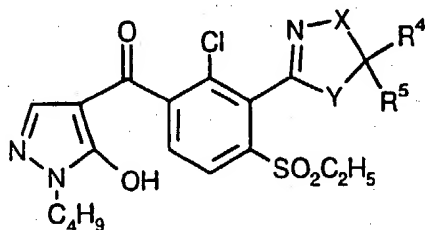
35

- die Verbindungen Ib93.1-Ib93.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib93

45



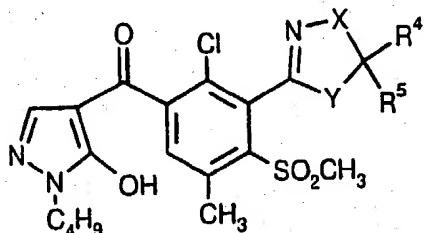
57

- die Verbindungen Ib94.1-Ib94.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib94

10

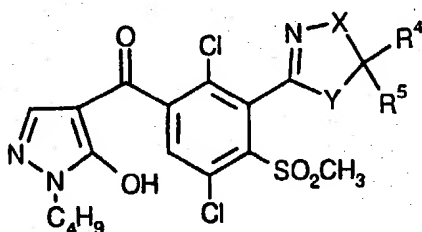


15

- die Verbindungen Ib95.1-Ib95.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib95

20



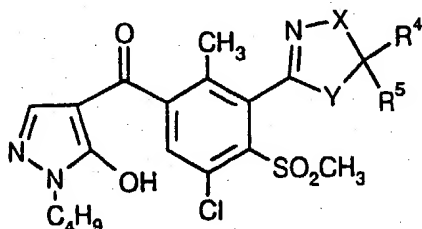
25

- die Verbindungen Ib96.1-Ib96.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib96

35

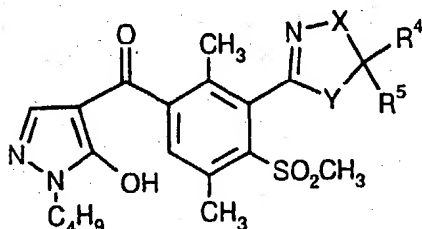


40

- die Verbindungen Ib97.1-Ib97.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

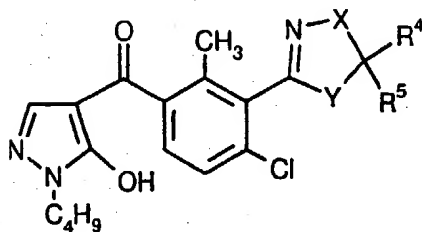
45

Ib97



- die Verbindungen Ib98.1-Ib98.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

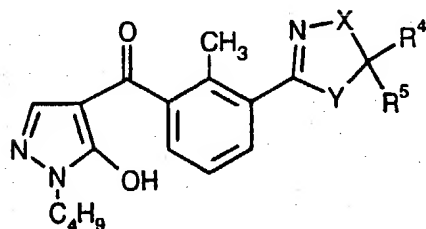


Ib98

10

- die Verbindungen Ib99.1-Ib99.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

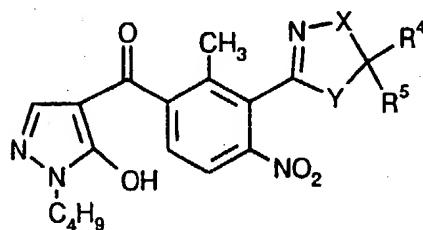


Ib99

20

- die Verbindungen Ib100.1-Ib100.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

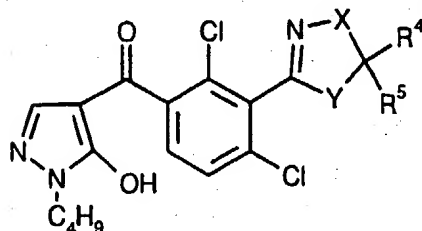


Ib100

30

- die Verbindungen Ib101.1-Ib101.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib101

40

45

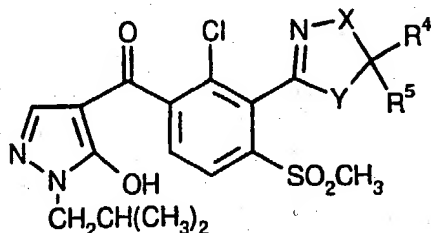
59

- die Verbindungen Ib102.1-Ib102.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib102

10

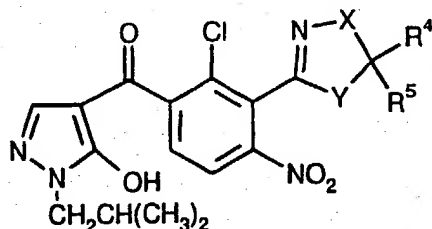


15

- die Verbindungen Ib103.1-Ib103.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib103

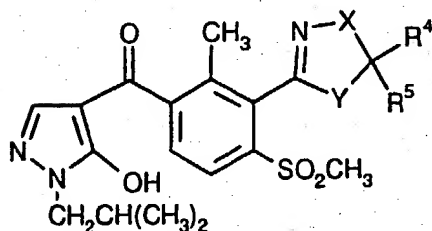


25

- die Verbindungen Ib104.1-Ib104.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib104



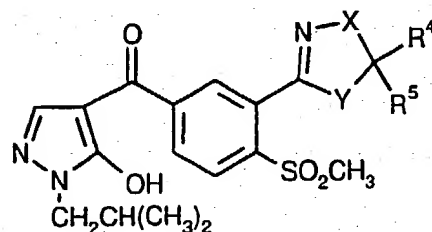
35

- die Verbindungen Ib105.1-Ib105.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Wasserstoff, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib105

45



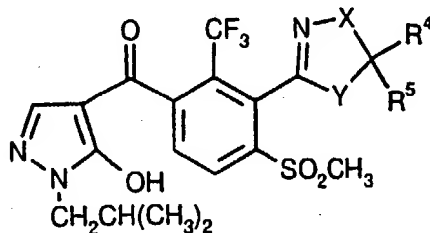
60

- die Verbindungen Ib106.1-Ib106.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Trifluormethyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib106

10

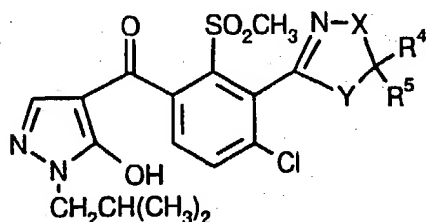


- die Verbindungen Ib107.1-Ib107.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib107

20

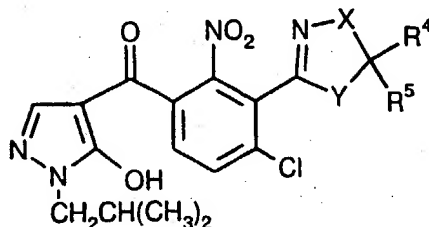


25

- die Verbindungen Ib108.1-Ib108.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib108



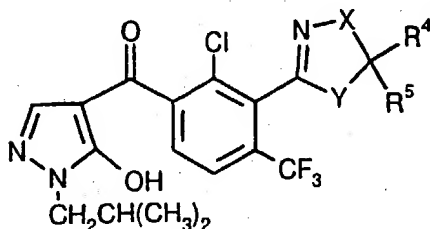
35

- die Verbindungen Ib109.1-Ib109.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib109

45

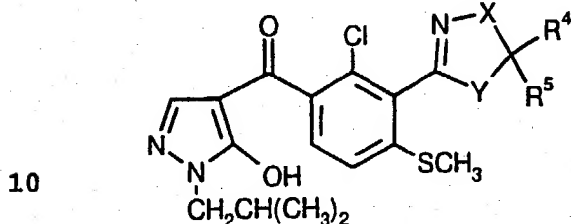


61

- die Verbindungen Ib110.1-Ib110.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylthio, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib110

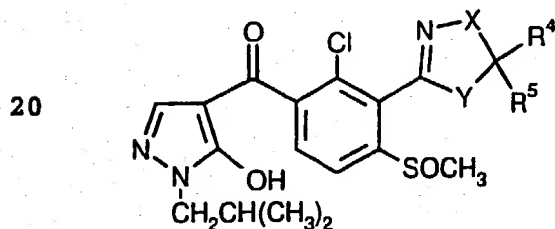


10

- die Verbindungen Ib111.1-Ib111.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfinyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib111

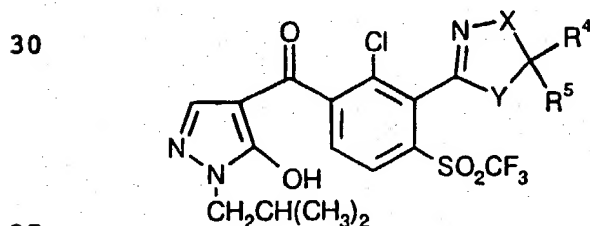


20

- die Verbindungen Ib112.1-Ib112.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Trifluormethylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib112

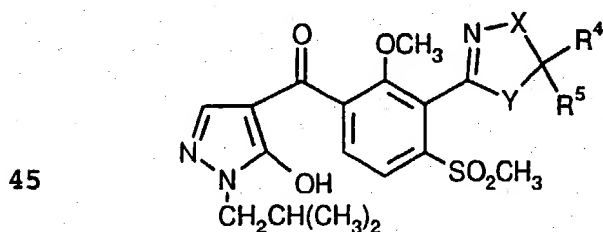


30

- die Verbindungen Ib113.1-Ib113.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib113



40

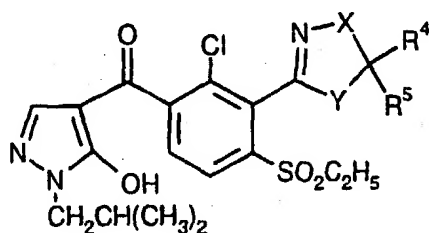
45

- die Verbindungen Ib114.1-Ib114.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib114

10

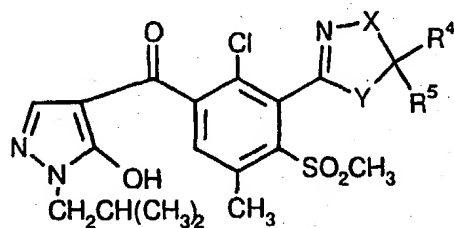


15

- die Verbindungen Ib115.1-Ib115.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib115



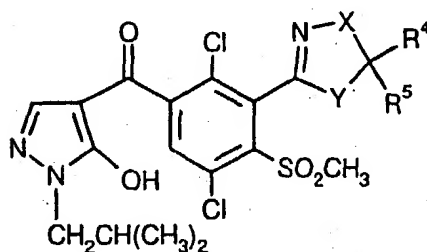
25

- die Verbindungen Ib116.1-Ib116.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib116

35



40

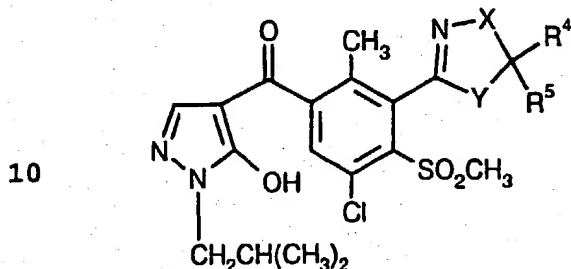
45

63

- die Verbindungen Ib117.1-Ib117.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Chlor, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

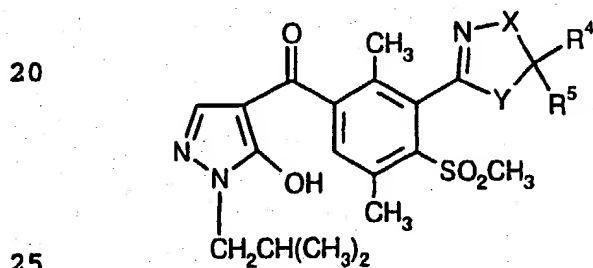
Ib117



- die Verbindungen Ib118.1-Ib118.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^3 für Methyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

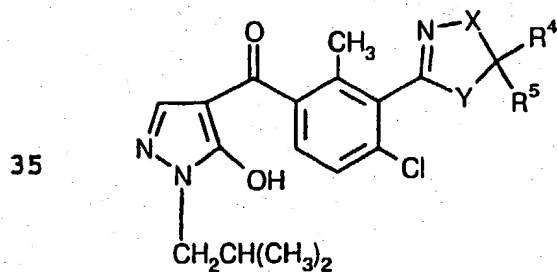
Ib118



- die Verbindungen Ib119.1-Ib119.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib119



40

45

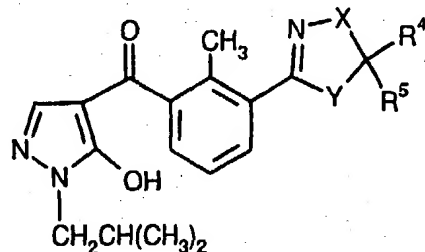
64

- die Verbindungen Ib120.1-Ib120.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Wasserstoff, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib120

10

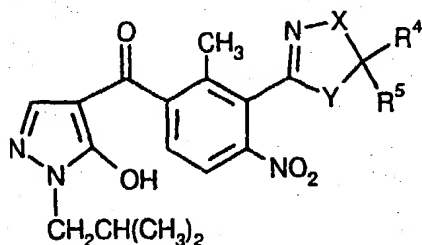


15

- die Verbindungen Ib121.1-Ib121.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Nitro, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib121

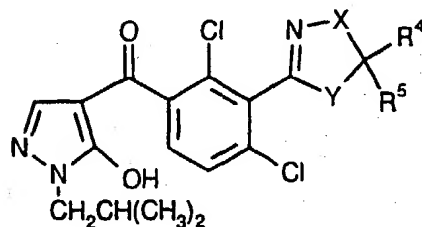


25

- die Verbindungen Ib122.1-Ib122.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib122

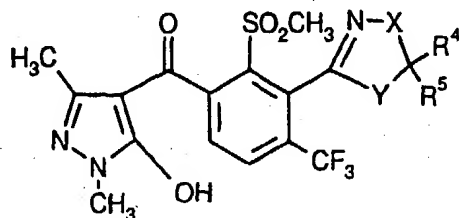


35

- die Verbindungen Ib123.1-Ib123.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl und R^2 für Trifluormethyl stehen.

40

Ib123



45

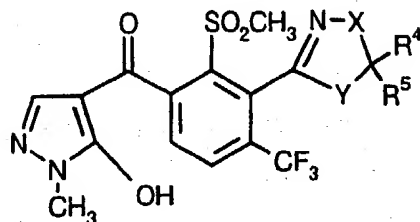
65

- die Verbindungen Ib124.1-Ib124.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^2 für Trifluormethyl, und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib124

10

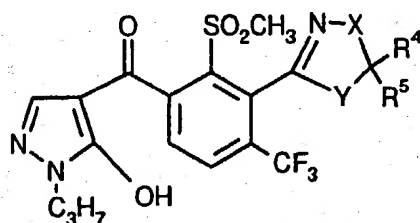


15

- die Verbindungen Ib125.1-Ib125.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib125

20

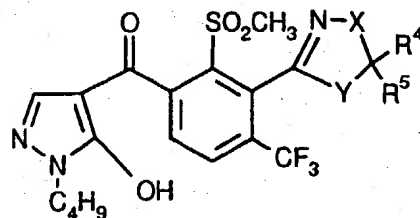


25

- die Verbindungen Ib126.1-Ib126.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib126

30

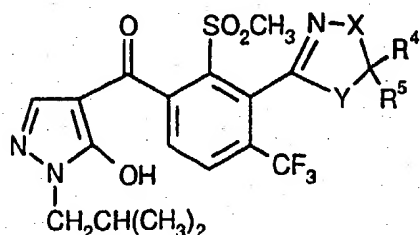


35

- die Verbindungen Ib127.1-Ib127.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

Ib127

40

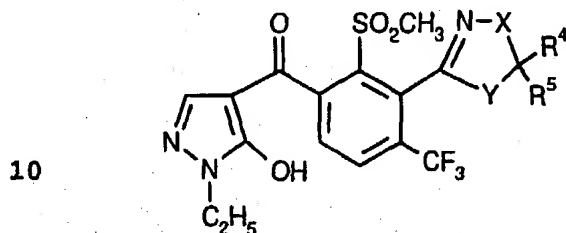


45

- die Verbindungen Ib128.1-Ib128.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^2 für Trifluormethyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

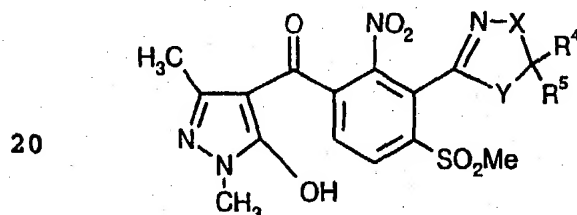
Ib128



- die Verbindungen Ib129.1-Ib129.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro und R^2 für Methylsulfonyl stehen.

15

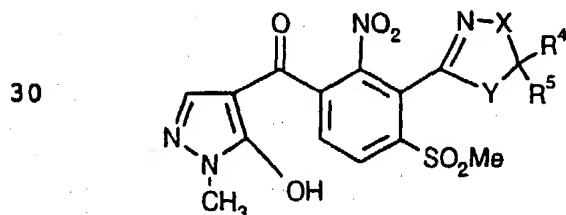
Ib129



- die Verbindungen Ib130.1-Ib130.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

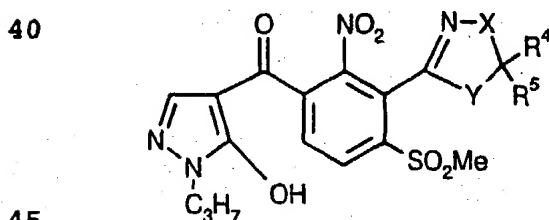
Ib130



- 35 - die Verbindungen Ib131.1-Ib131.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Propyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib131



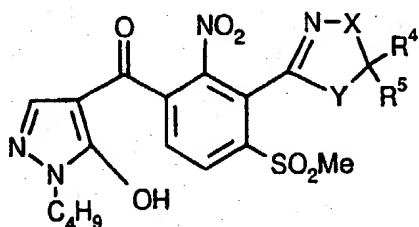
67

- die Verbindungen Ib132.1-Ib132.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für n-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib132

10

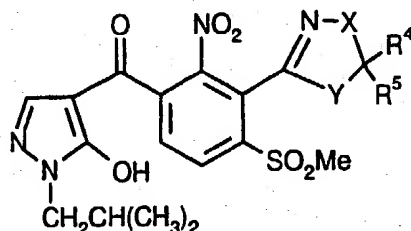


15

- die Verbindungen Ib133.1-Ib133.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für iso-Butyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib133

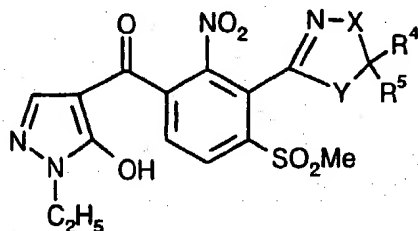


25

- die Verbindungen Ib134.1-Ib134.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib134



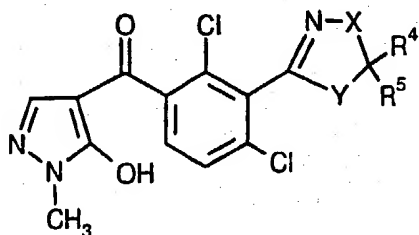
35

- die Verbindungen Ib135.1-Ib135.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{18} für Wasserstoff steht.

40

Ib135

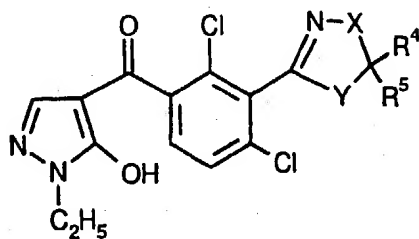
45



68

- die Verbindungen Ib136.1-Ib136.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

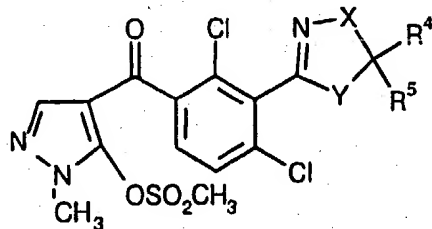


Ib136

10

- die Verbindungen Ib137.1-Ib137.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

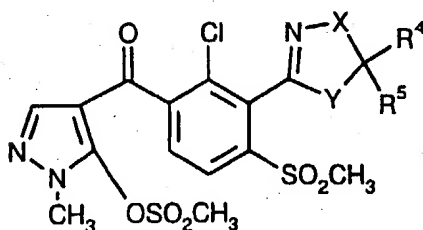


Ib137

20

- die Verbindungen Ib138.1-Ib138.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

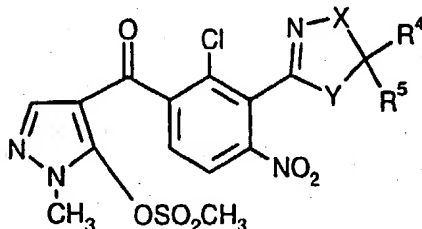


Ib138

30

- die Verbindungen Ib139.1-Ib139.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib139

40

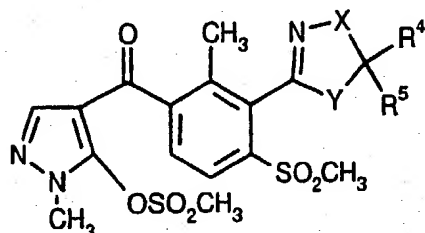
45

69

- die Verbindungen Ib140.1-Ib140.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

5

10

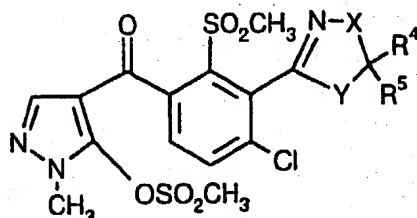


Ib140

- die Verbindungen Ib141.1-Ib141.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

20

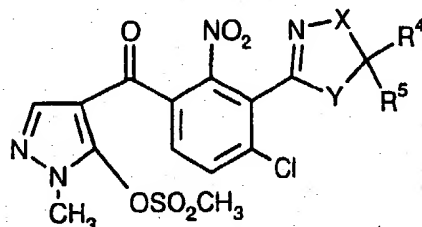


Ib141

- die Verbindungen Ib142.1-Ib142.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

30



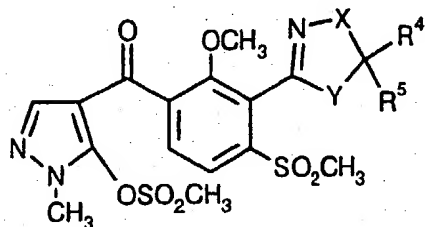
Ib142

- die Verbindungen Ib143.1-Ib143.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² und Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

40

45

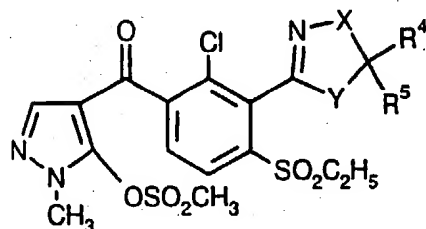


Ib143

- die Verbindungen Ib144.1-Ib144.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

5

10

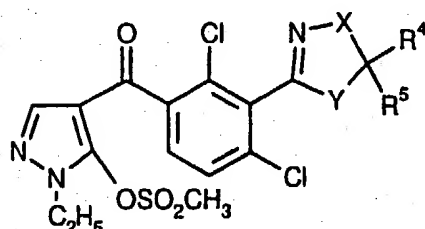


Ib144

- die Verbindungen Ib145.1-Ib145.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

20

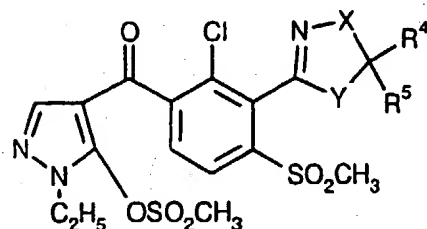


Ib145

- die Verbindungen Ib146.1-Ib146.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25

30



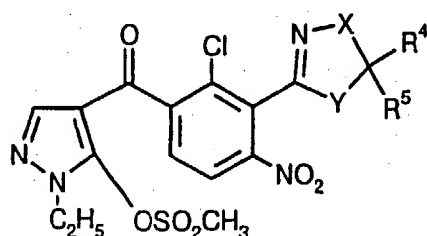
Ib146

- die Verbindungen Ib147.1-Ib147.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35

40

45



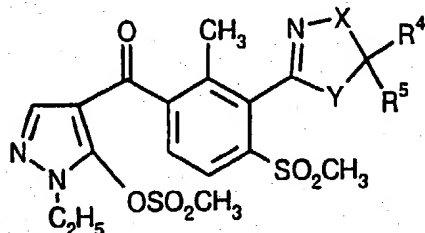
Ib147

71

- die Verbindungen Ib148.1-Ib148.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

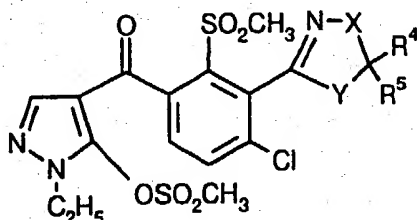


Ib148

- die Verbindungen Ib149.1-Ib149.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

20

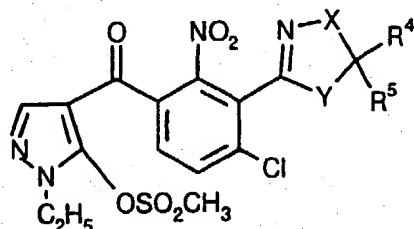


Ib149

- die Verbindungen Ib150.1-Ib150.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

30



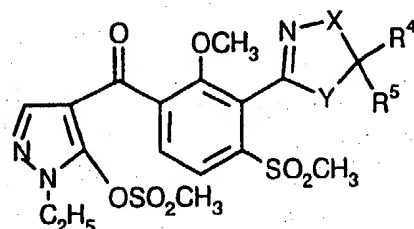
Ib150

35

- die Verbindungen Ib151.1-Ib151.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

45



Ib151

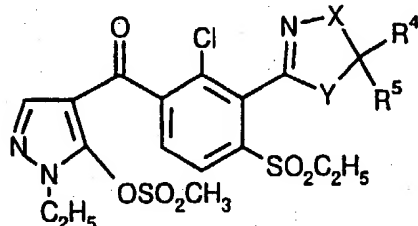
72

- die Verbindungen Ib152.1-Ib152.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib152

10

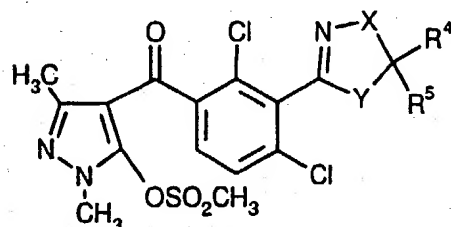


- die Verbindungen Ib153.1-Ib153.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl steht.

15

Ib153

20

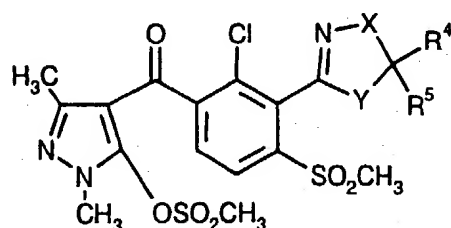


- die Verbindungen Ib154.1-Ib154.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 und Z für Methylsulfonyl stehen.

25

Ib154

30

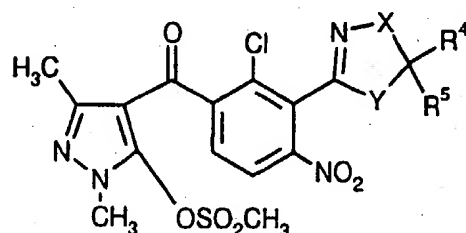


- die Verbindungen Ib155.1-Ib155.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

35

Ib155

40

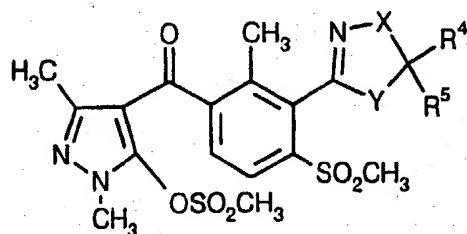


45

73

- die Verbindungen Ib156.1-Ib156.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 und Z für Methylsulfonyl stehen.

5

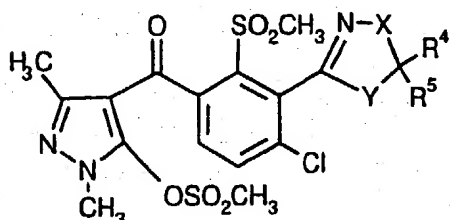


Ib156

10

- die Verbindungen Ib157.1-Ib157.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 und Z für Methylsulfonyl stehen.

15

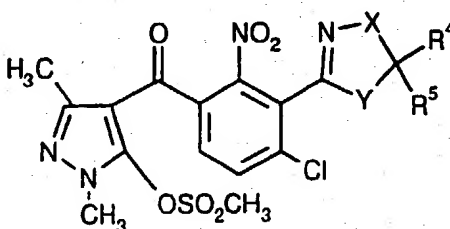


Ib157

20

- die Verbindungen Ib158.1-Ib158.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

25

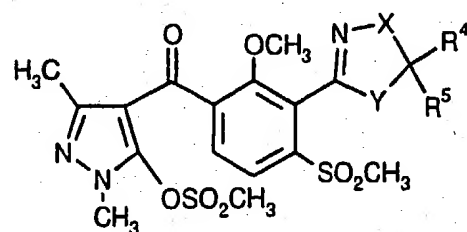


Ib158

30

- die Verbindungen Ib159.1-Ib159.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 und Z für Methylsulfonyl stehen.

35

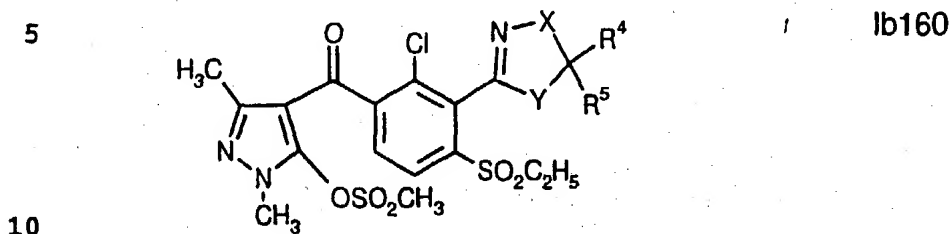


Ib159

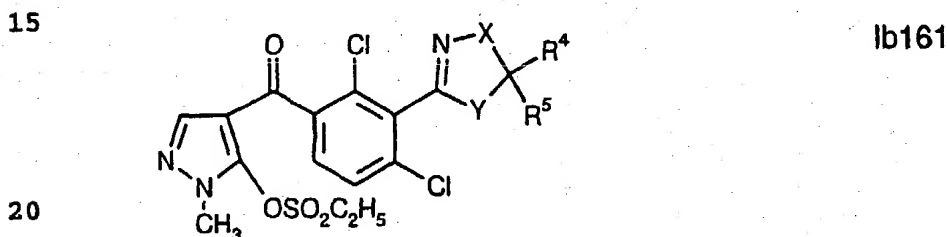
40

45

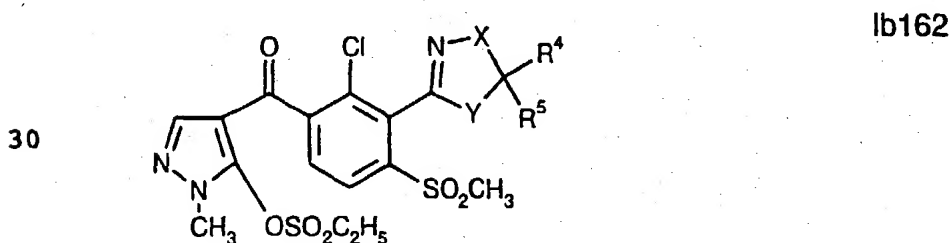
- die Verbindungen Ib160.1-Ib160.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl und Z für Methylsulfonyl stehen.



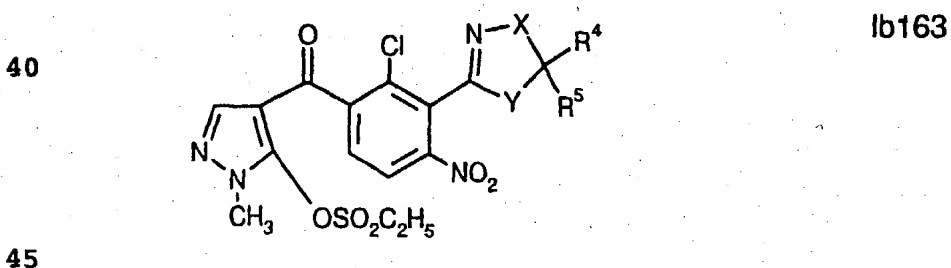
- die Verbindungen Ib161.1-Ib161.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- die Verbindungen Ib162.1-Ib162.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



- die Verbindungen Ib163.1-Ib163.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.



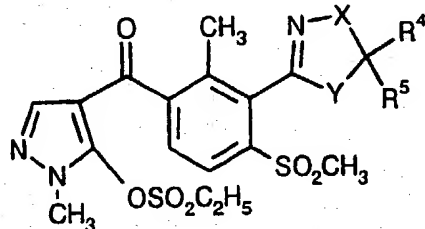
75

- die Verbindungen Ib164.1-Ib164.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib164

10

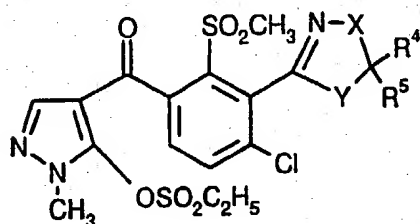


15

- die Verbindungen Ib165.1-Ib165.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib165

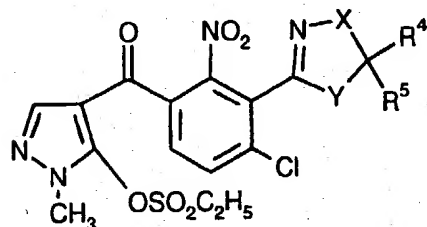


25

- die Verbindungen Ib166.1-Ib166.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib166



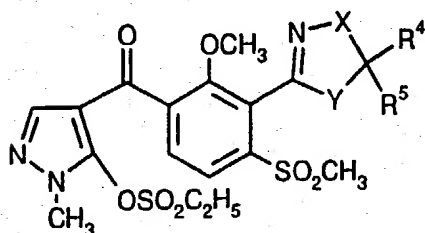
35

- die Verbindungen Ib167.1-Ib167.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib167

45



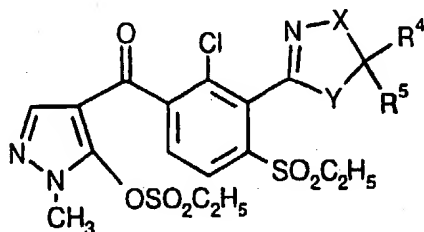
76

- die Verbindungen Ib168.1-Ib168.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 und Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib168

10

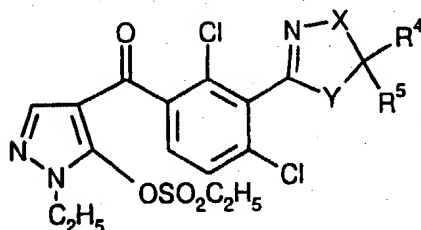


- die Verbindungen Ib169.1-Ib169.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib169

20

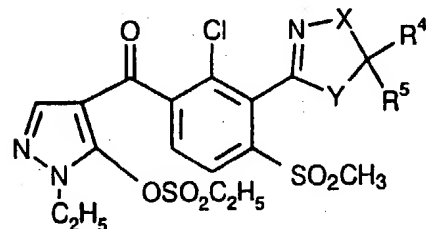


25

- die Verbindungen Ib170.1-Ib170.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib170



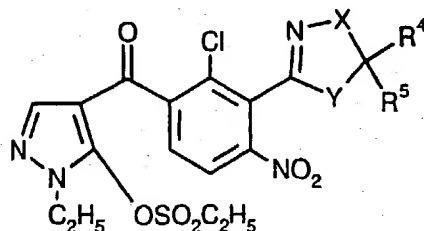
35

- die Verbindungen Ib171.1-Ib171.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib171

45

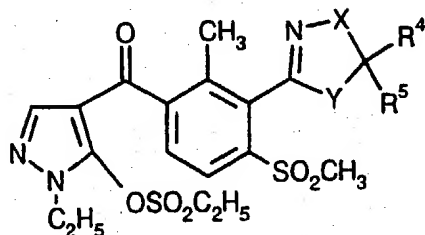


- die Verbindungen Ib172.1-Ib172.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib172

10

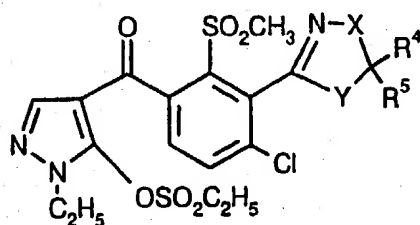


- die Verbindungen Ib173.1-Ib173.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib173

20

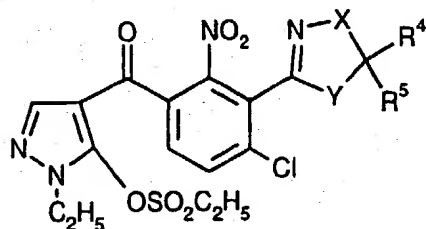


- die Verbindungen Ib174.1-Ib174.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib174

30



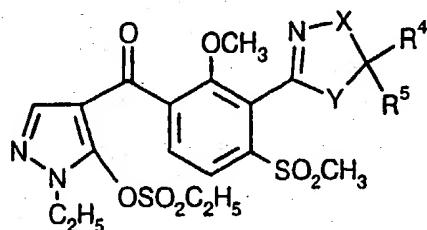
35

- die Verbindungen Ib175.1-Ib175.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

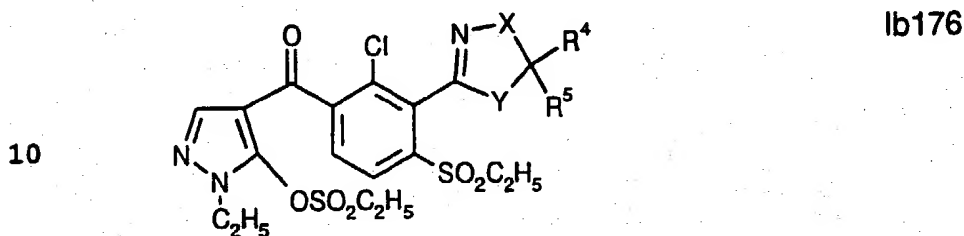
40

Ib175

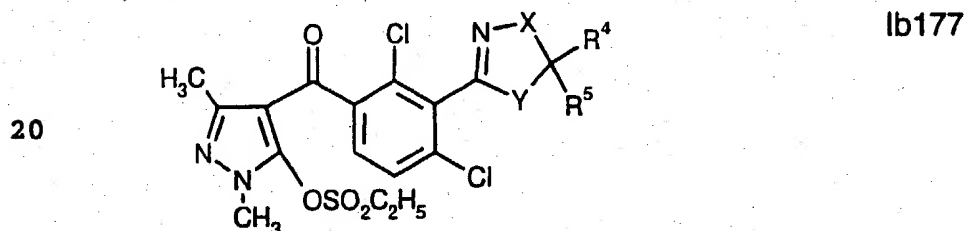
45



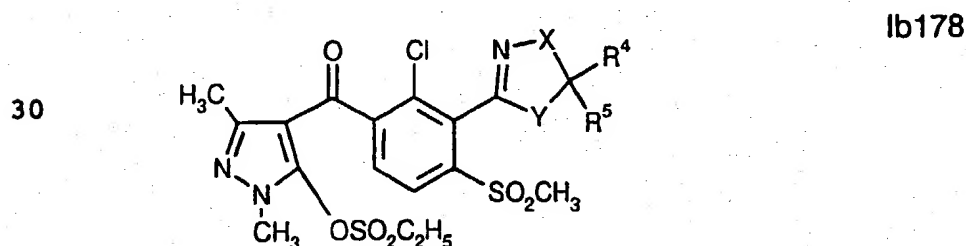
- 5 - die Verbindungen Ib176.1-Ib176.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.



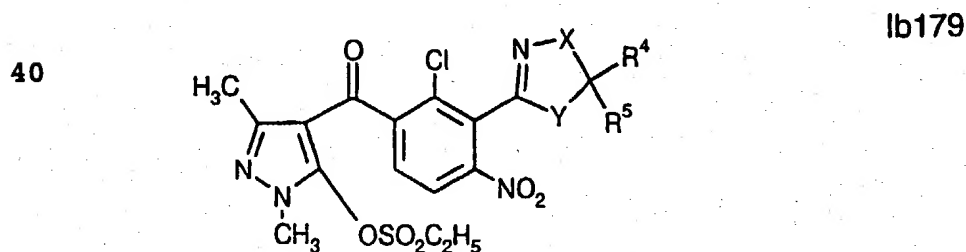
- 15 - die Verbindungen Ib177.1-Ib177.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Ethylsulfonyl steht.



- 25 - die Verbindungen Ib178.1-Ib178.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.



- 35 - die Verbindungen Ib179.1-Ib179.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

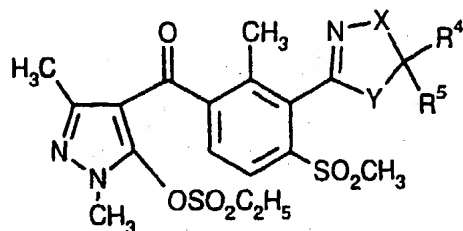


45

- die Verbindungen Ib180.1-Ib180.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

5

10

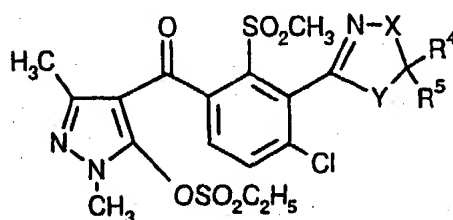


Ib180

- die Verbindungen Ib181.1-Ib181.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

15

20

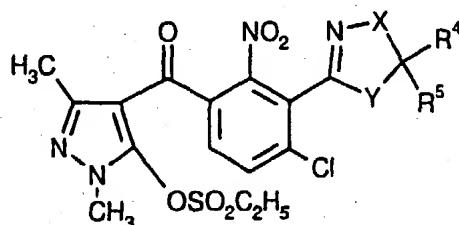


Ib181

- die Verbindungen Ib182.1-Ib182.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

25

30

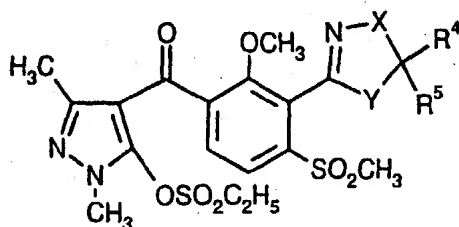


Ib182

- die Verbindungen Ib183.1-Ib183.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

35

40



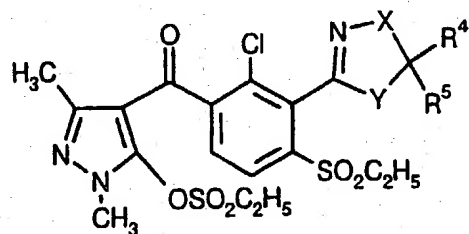
Ib183

45

80

- die Verbindungen Ib184.1-Ib184.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 und Z für Ethylsulfonyl stehen.

5

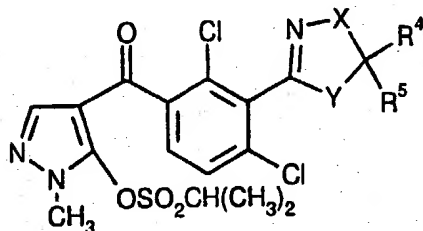


Ib184

10

- die Verbindungen Ib185.1-Ib185.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

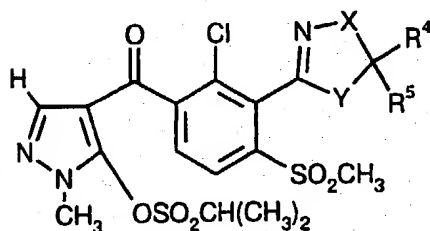


Ib185

20

- die Verbindungen Ib186.1-Ib186.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

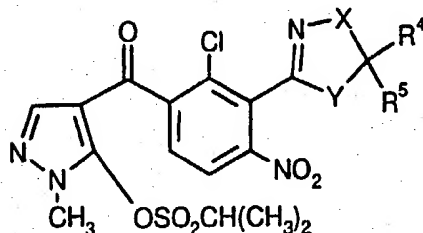


Ib186

30

- die Verbindungen Ib187.1-Ib187.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35



Ib187

40

45

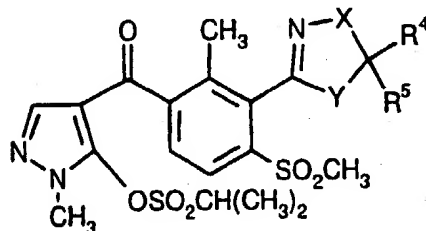
81

- die Verbindungen Ib188.1-Ib188.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

5

Ib188

10

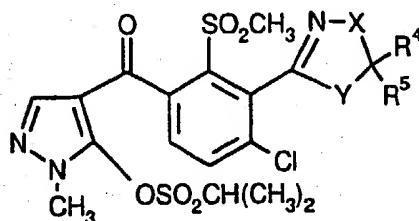


- die Verbindungen Ib189.1-Ib189.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

Ib189

20

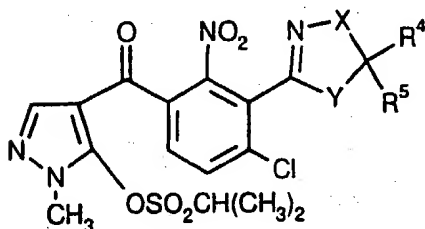


25

- die Verbindungen Ib190.1-Ib190.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

30

Ib190



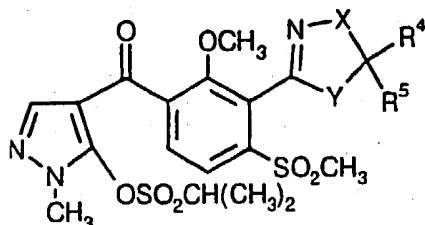
35

- die Verbindungen Ib191.1-Ib191.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

40

Ib191

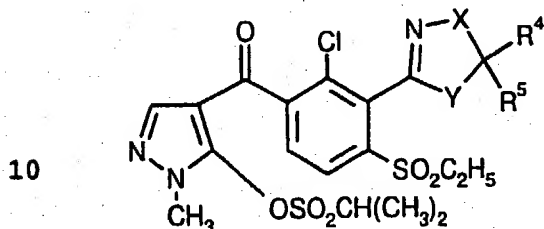
45



- die Verbindungen Ib192.1-Ib192.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

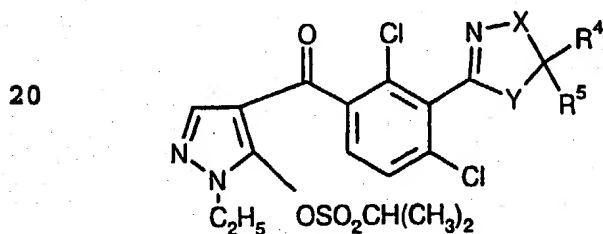
Ib192



- die Verbindungen Ib193.1-Ib193.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

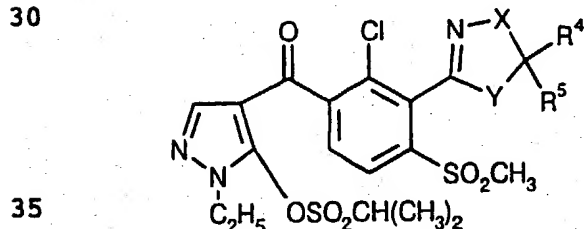
Ib193



- 25 - die Verbindungen Ib194.1-Ib194.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

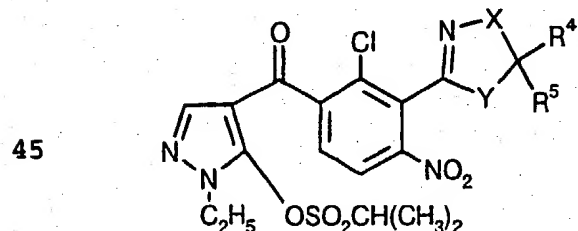
Ib194



- die Verbindungen Ib195.1-Ib195.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

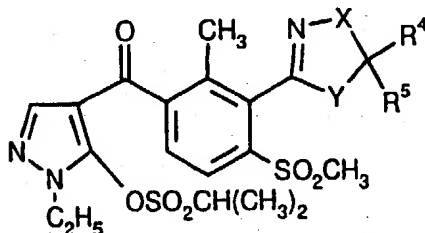
Ib195



- die Verbindungen Ib196.1-Ib196.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

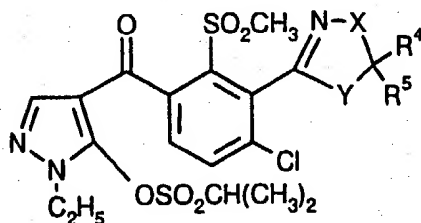


Ib196

15

- die Verbindungen Ib197.1-Ib197.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

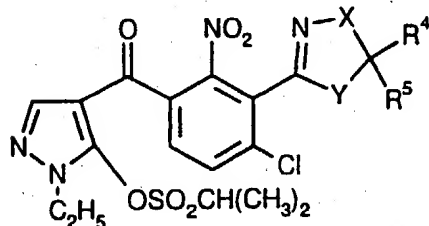


Ib197

25

- die Verbindungen Ib198.1-Ib198.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30



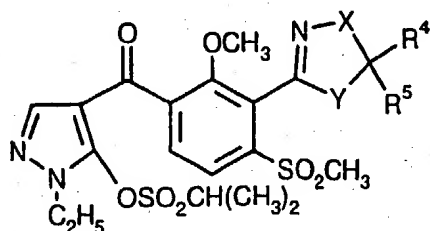
Ib198

35

- die Verbindungen Ib199.1-Ib199.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

45



Ib199

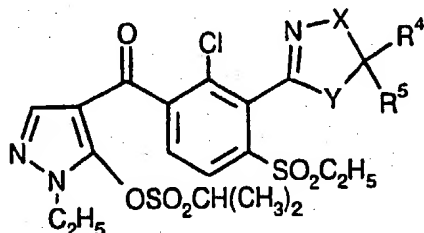
84

- die Verbindungen Ib200.1-Ib200.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib200

10

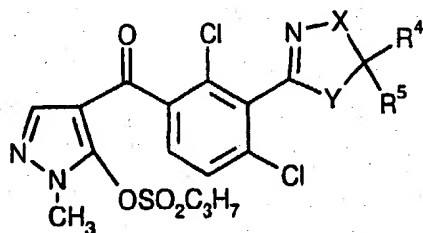


- die Verbindungen Ib201.1-Ib201.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib201

20

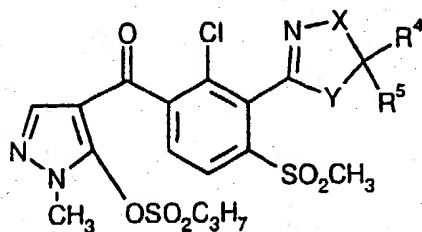


25

- die Verbindungen Ib202.1-Ib202.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib202

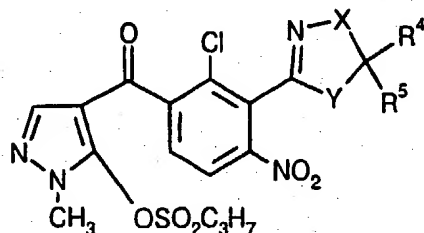


35

- die Verbindungen Ib203.1-Ib203.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib203



45

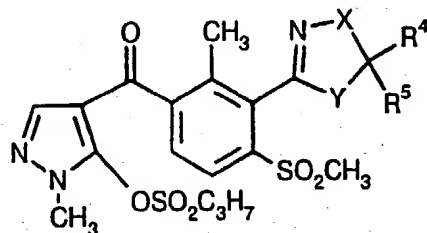
85

- die Verbindungen Ib204.1-Ib204.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib204

10

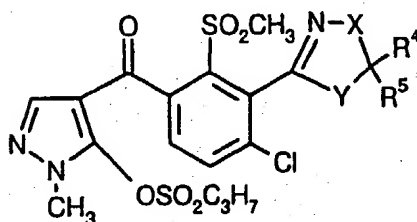


- die Verbindungen Ib205.1-Ib205.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib205

20

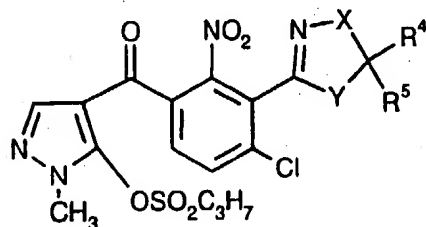


25

- die Verbindungen Ib206.1-Ib206.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib206



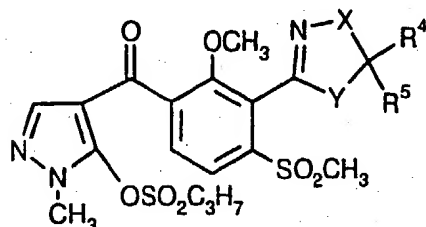
35

- die Verbindungen Ib207.1-Ib207.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib207

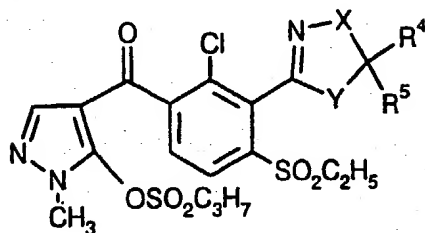
45



- die Verbindungen Ib.208.1-Ib208.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

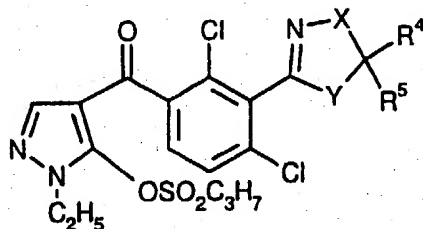


Ib208

- die Verbindungen Ib209.1-Ib209.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

20



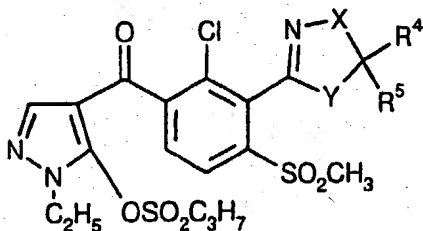
Ib209

25

- die Verbindungen Ib210.1-Ib210.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

35

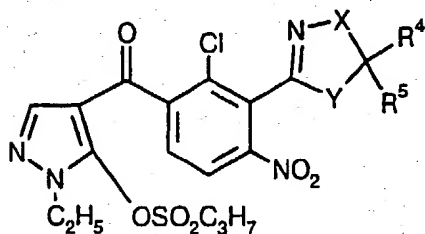


Ib210

40

- die Verbindungen Ib211.1-Ib211.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

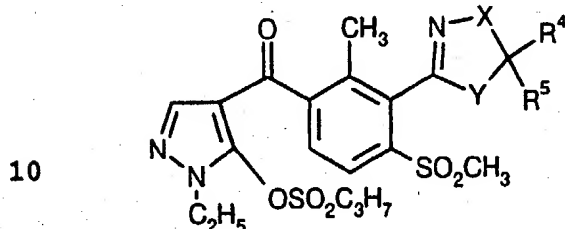


Ib211

- die Verbindungen Ib212.1-Ib212.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib212

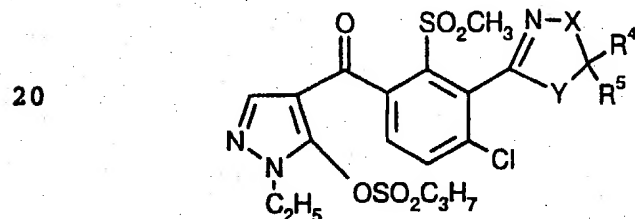


10

- die Verbindungen Ib213.1-Ib213.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib213

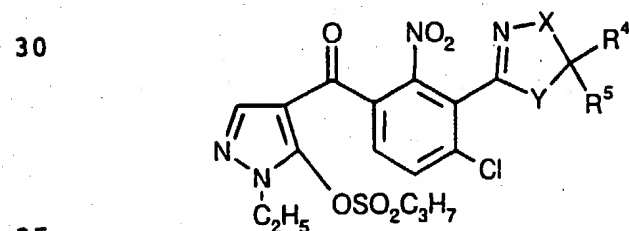


20

- die Verbindungen Ib214.1-Ib214.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib214



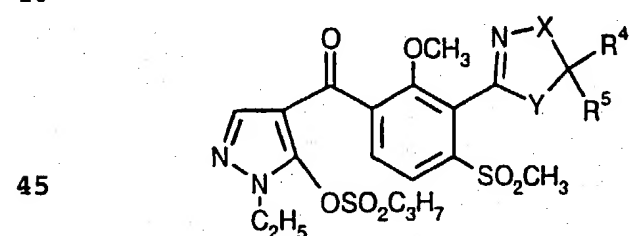
30

35

- die Verbindungen Ib215.1-Ib215.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib215



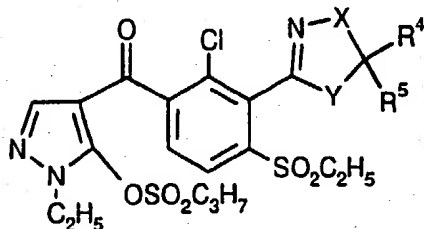
45

- die Verbindungen Ib216.1-Ib216.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib216

10

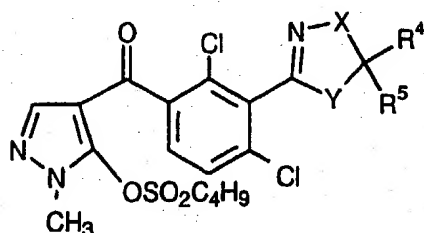


- die Verbindungen Ib217.1-Ib217.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib217

20



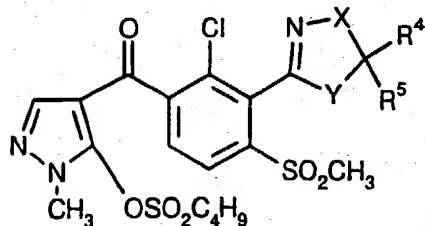
25

- die Verbindungen Ib218.1-Ib218.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib218

35

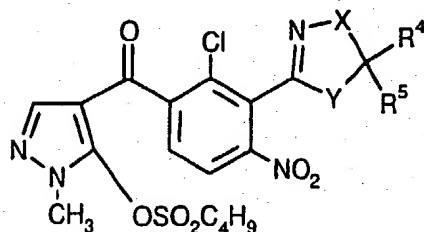


40

- die Verbindungen Ib219.1-Ib219.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

45

Ib 219

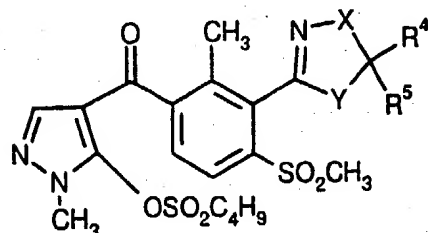


- die Verbindungen Ib220.1-Ib220.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib220

10

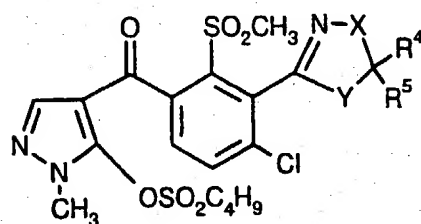


15

- die Verbindungen Ib221.1-Ib221.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib221

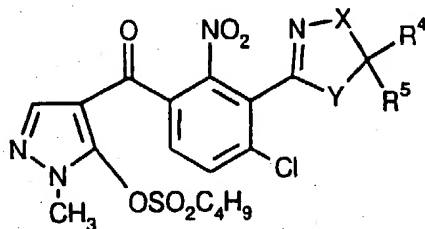


25

- die Verbindungen Ib222.1-Ib222.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib222



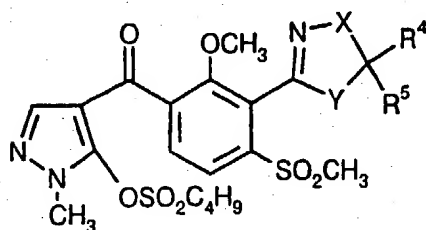
35

- die Verbindungen Ib223.1-Ib223.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib223

45



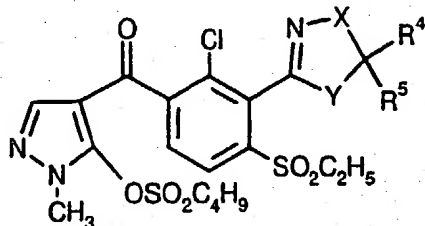
90

- die Verbindungen Ib224.1-Ib224.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib224

10

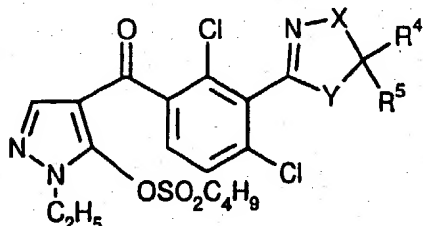


- die Verbindungen Ib225.1-Ib225.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib225

20



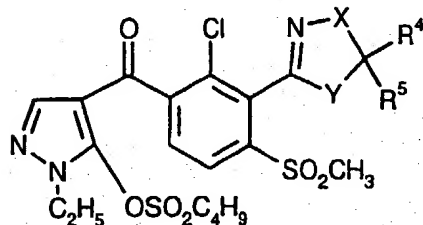
25

- die Verbindungen Ib226.1-Ib226.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib226

35

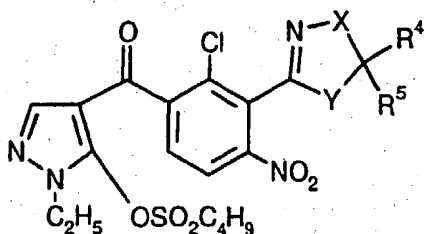


40

- die Verbindungen Ib227.1-Ib227.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

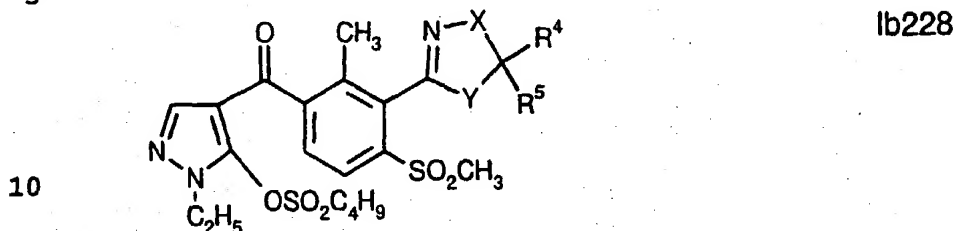
45

Ib227



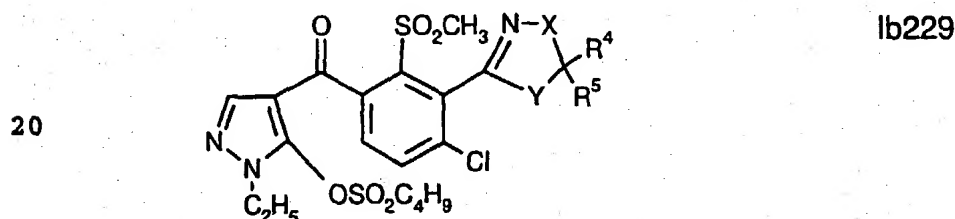
die Verbindungen Ib228.1-Ib228.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

5



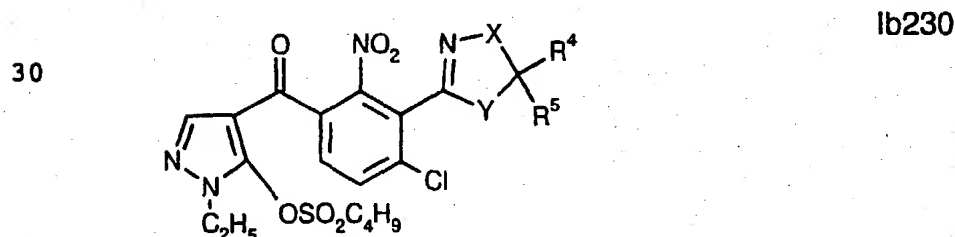
die Verbindungen Ib229.1-Ib229.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15



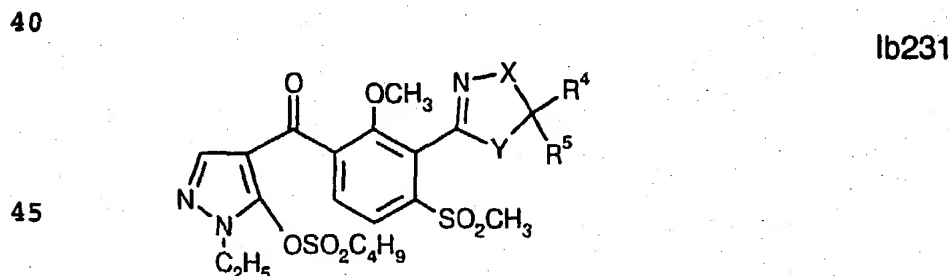
die Verbindungen Ib230.1-Ib230.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

25



die Verbindungen Ib231.1-Ib231.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

35



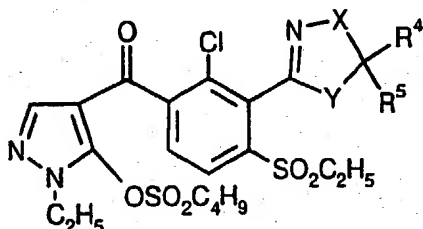
45

- die Verbindungen Ib232.1-Ib232.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib232

10

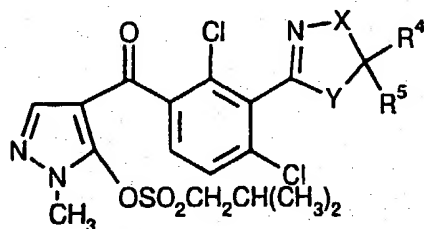


- die Verbindungen Ib233.1-Ib233.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib233

20

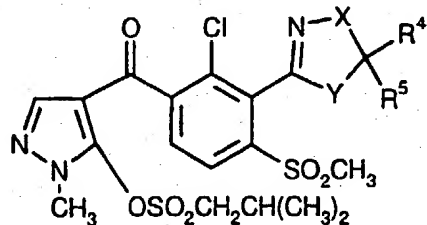


25

- die Verbindungen Ib234.1-Ib234.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib234



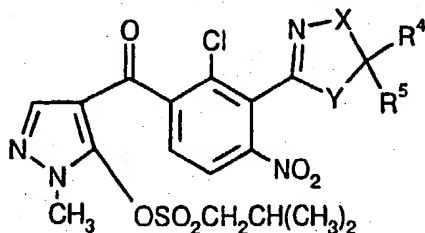
35

- die Verbindungen Ib235.1-Ib235.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib235

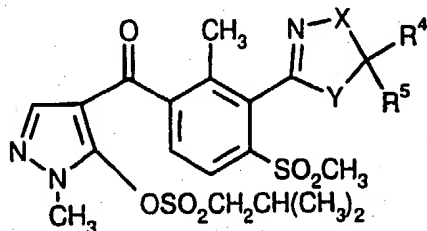
45



- die Verbindungen Ib236.1-Ib236.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

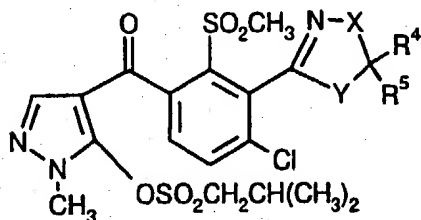


Ib236

- die Verbindungen Ib237.1-Ib237.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

20

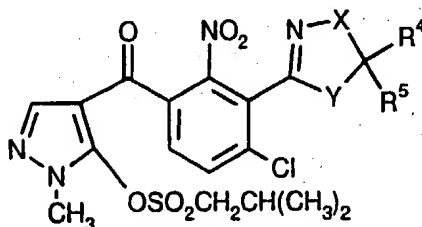


Ib237

25

- die Verbindungen Ib238.1-Ib238.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30



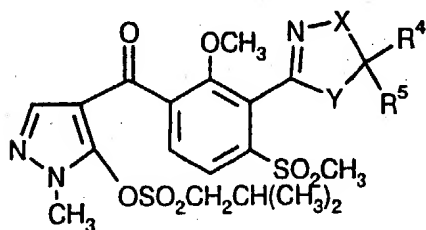
Ib238

35

- die Verbindungen Ib239.1-Ib239.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

45



Ib239

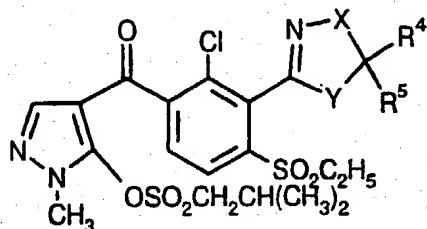
94

- die Verbindungen Ib240.1-Ib240.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib240

10

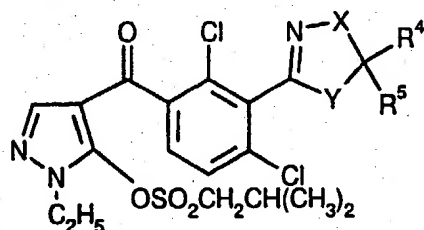


- die Verbindungen Ib241.1-Ib241.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib241

20

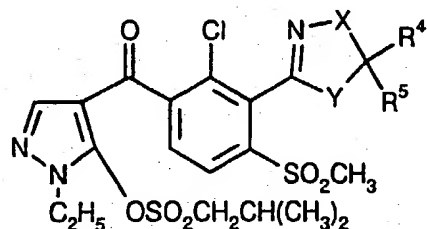


- die Verbindungen Ib242.1-Ib242.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib242

30



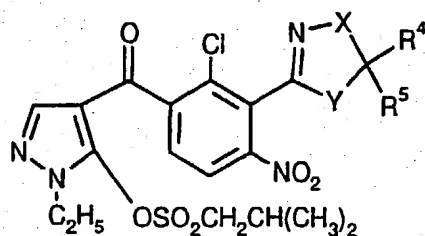
35

- die Verbindungen Ib243.1-Ib243.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

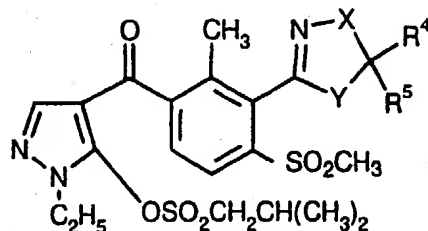
Ib243

45



- die Verbindungen Ib244.1-Ib244.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

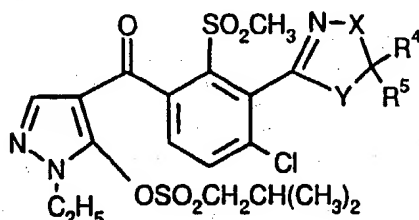


Ib244

10

- die Verbindungen Ib245.1-Ib245.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

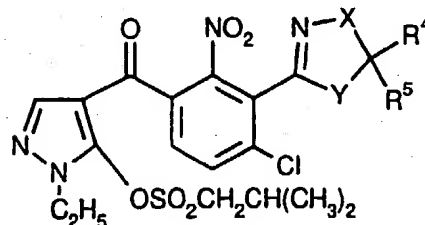


Ib245

20

- die Verbindungen Ib246.1-Ib246.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Nitro, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25



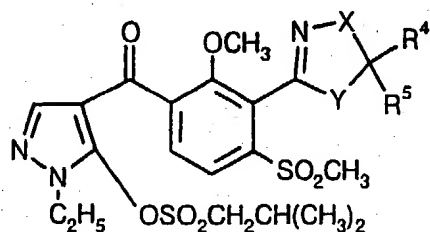
Ib246

30

35

- die Verbindungen Ib247.1-Ib247.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methoxy, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40



Ib247

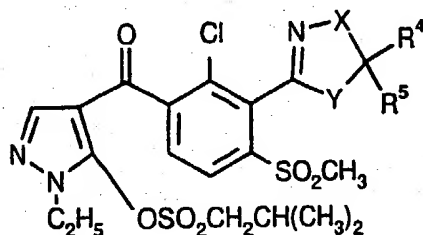
45

- die Verbindungen Ib248.1-Ib248.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib248

10

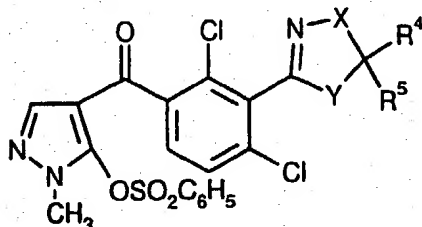


- die Verbindungen Ib249.1-Ib249.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Phenylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib249

20



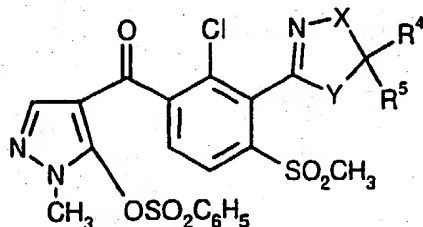
25

- die Verbindungen Ib250.1-Ib250.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

Ib250

35

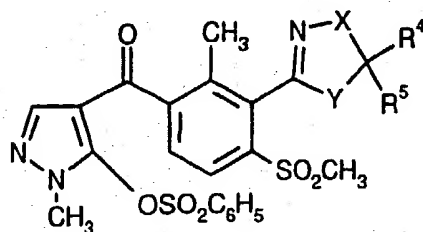


- die Verbindungen Ib251.1-Ib251.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

40

Ib251

45

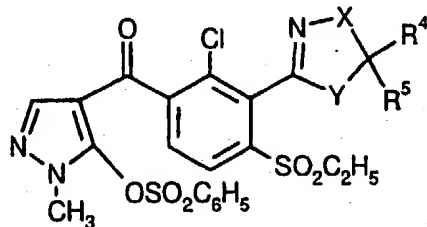


- die Verbindungen Ib252.1-Ib252.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Ethylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

5

Ib252

10

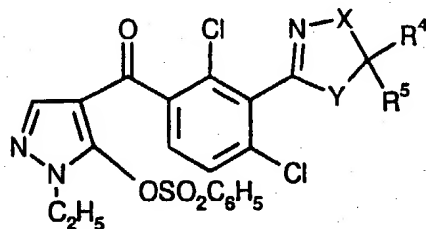


- die Verbindungen Ib253.1-Ib253.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

15

Ib253

20

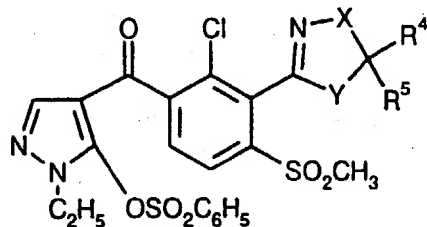


25

- die Verbindungen Ib254.1-Ib254.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

30

Ib254



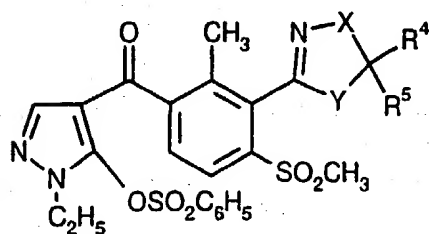
35

- die Verbindungen Ib255.1-Ib255.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R¹⁶ für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹⁸ für Wasserstoff stehen.

40

Ib255

45

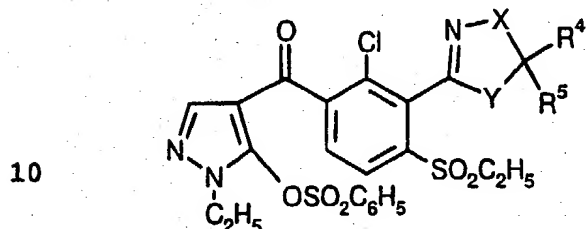


98

- die Verbindungen Ib256.1-Ib256.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib256

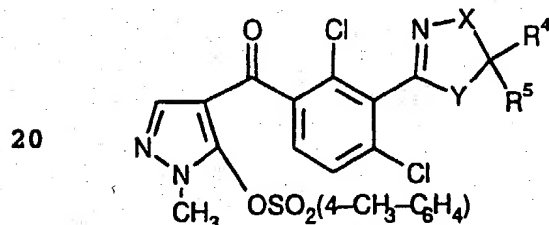


10

- die Verbindungen Ib257.1-Ib257.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

Ib257

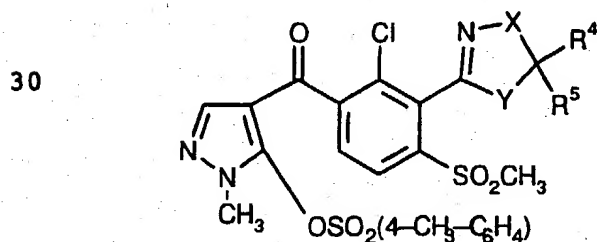


20

- die Verbindungen Ib258.1-Ib258.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

25

Ib258

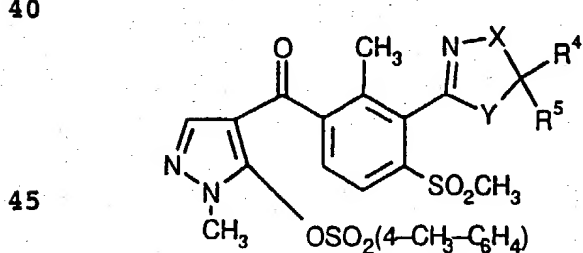


30

- die Verbindungen Ib259.1-Ib259.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

35

Ib259



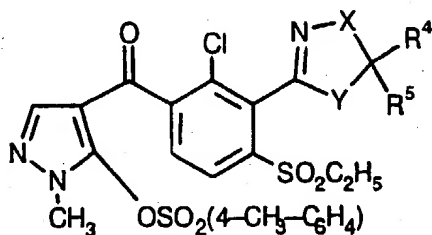
40

45

- die Verbindungen Ib260.1-Ib260.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

10

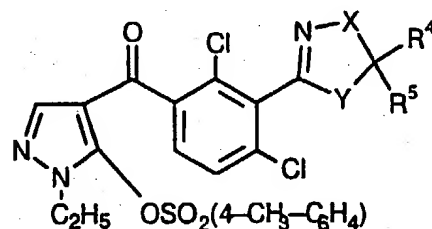


Ib260

- die Verbindungen Ib261.1-Ib261.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

15

20



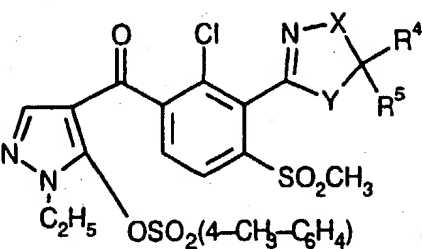
Ib261

25

- die Verbindungen Ib262.1-Ib262.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

30

35



Ib262

40

45

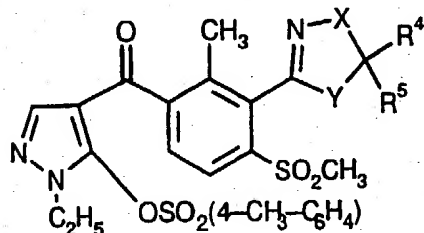
100

- die Verbindungen Ib263.1-Ib263.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^1 für Methyl, R^2 für Methylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

5

Ib263

10

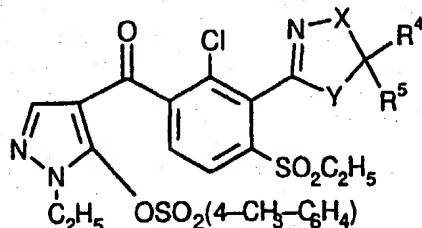


15

- die Verbindungen Ib264-Ib264.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R^2 für Ethylsulfonyl, R^{16} für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R^{18} für Wasserstoff stehen.

20

Ib264



25

Ebenso insbesondere bevorzugt sind 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

30

R^1 Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio oder C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl;
insbesondere Chlor, Methyl, Methylthio oder Methylsulfonyl;

35

R^2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl;
insbesondere Wasserstoff, Nitro, Chlor, Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;

40

R^3 Wasserstoff;

45

R^4, R^5 Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio oder COR^6 ;
insbesondere Wasserstoff, Fluor, Methyl, Ethyl, Propyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, 1-Chlor-eth-1-yl, Methoxy, Ethoxy, Ethylthio oder Ethoxycarbonyl;

oder

5 R^4 und R^5 bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein-
bis mehrfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann
und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
 C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein
kann;

10 R^6 C_1 - C_4 -Alkoxy;
insbesondere Ethyl;

X O oder $CR^{10}R^{11}$;

15 Y O, S oder $CR^{13}R^{14}$;

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl;
insbesondere Wasserstoff, Methyl oder Chlormethyl;

oder

20 R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein-
bis mehrfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann
und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
 C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein
25 kann;
insbesondere 1,3-Propdiyl;

R^{16} C_1 - C_6 -Alkyl;
insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl, 2-Methylpropyl oder
30 Butyl;

Z H oder SO_2R^{17} ;

35 R^{17} C_1 - C_4 -Alkyl;
insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl oder 2-Methylpropyl;

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-
methyl-sulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-
40 benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-
cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-
dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydro-
thiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-
1H-pyrazol;

45 sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze;
insbesondere Alkalimetallsalze und Ammoniumsalze.

Die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzolylderivate der Formel I sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgendem Verfahren:

5

Verfahren A:

Umsetzung von Pyrazolen der Formel II (mit $Z = H$) mit einer aktivierten Benzoessäure III α oder einer Benzoessäure III β , die vorzugsweise in situ aktiviert wird, zu dem Acylierungsprodukt und anschließende Umlagerung.

15

20

25

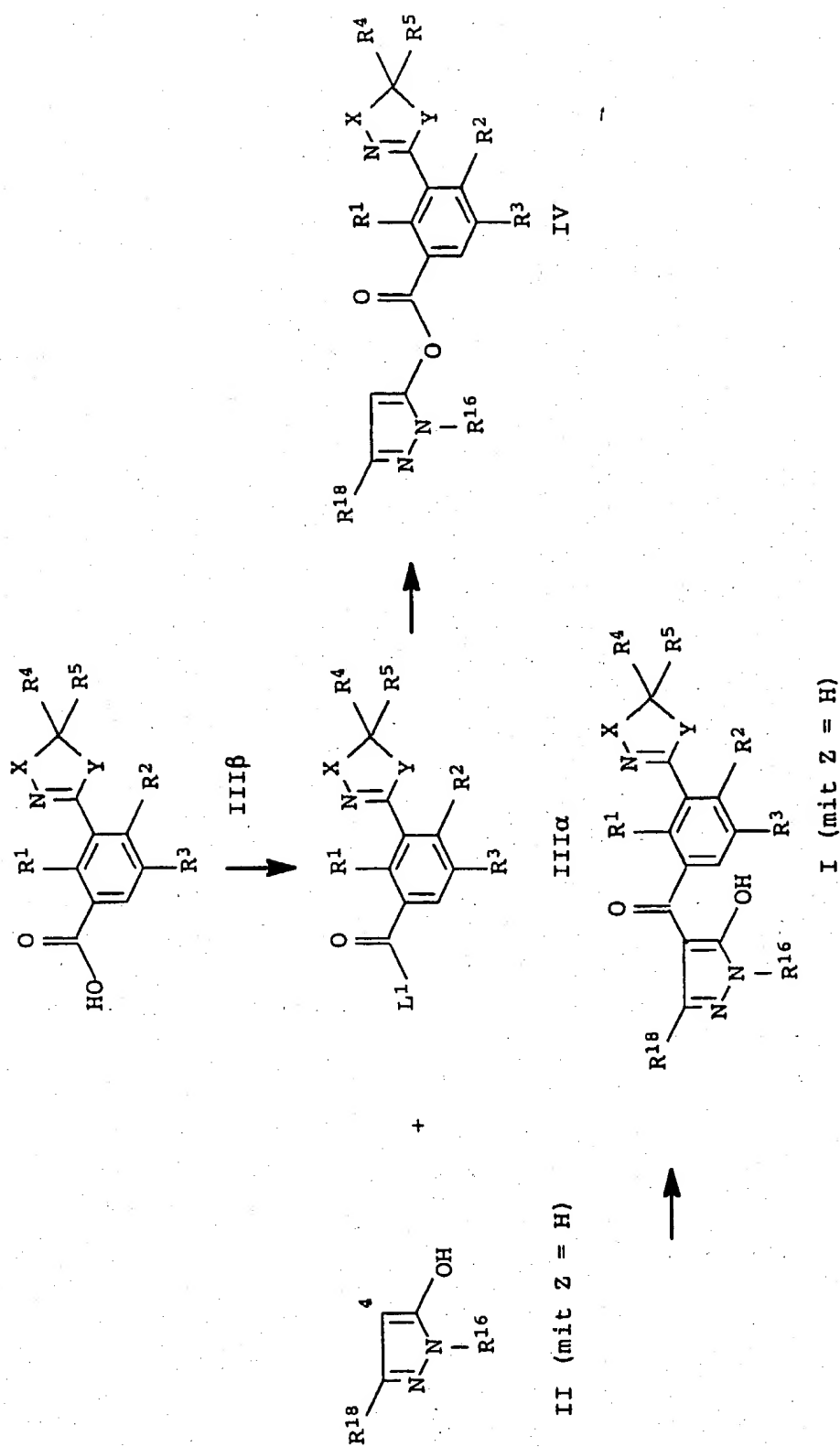
30

35

40

45

103



L¹ steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat, Trifluoracetat etc.

5

Die aktivierte Benzoessäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäureester, 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis

15 1,5 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte

20 Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäure-

25 ethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Benzoylhalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0 - 10°C abzukühlen. Anschließend rührt man bei 20 - 100°C, vorzugsweise bei 25 - 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäure-

30 ethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden.

Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt

40 zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

5

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonat, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt

10 werden Triethylamin oder Alkalicarbonat verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolaren Verhältnis in Bezug auf den Ester.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie

15 Acetoncyanhydrin, Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

20

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid, Essigsäureethyl-

25 ester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5-10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeeengt.

30 (Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen und für die Umlagerung der Ester sind z.B. in EP-A 282 944 und US 4 643 757 genannt).

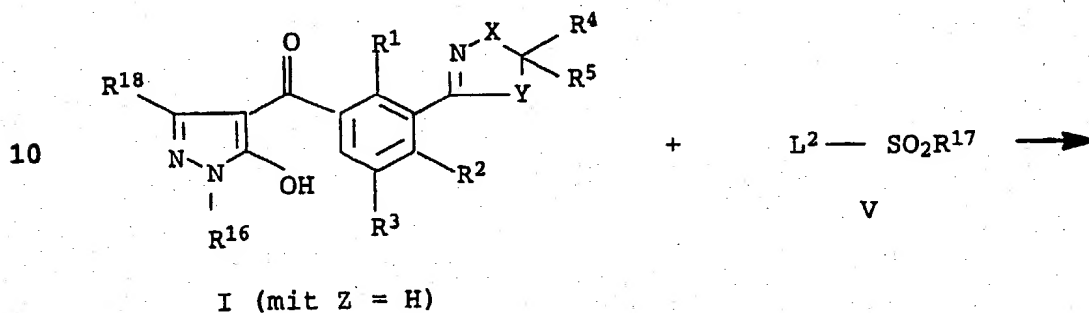
35

40

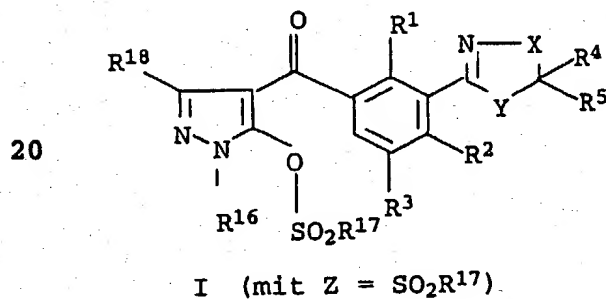
45

Verfahren B:

Umsetzung von 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I (mit $Z = H$) mit einer Verbindung der Formel V (mit $Z = SO_2R^{17}$):



15



25

L^2 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen, z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Sulfonat, z.B. OSO_2R^{17} .

30 Die Verbindungen der Formel V können direkt eingesetzt werden, wie z.B. im Fall der Sulfonsäurehalogenide, Sulfonsäureanhydride oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Sulfonsäuren (mittels Sulfonsäure und Dicyclohexylcarbonyldiimid, Carbonyldiimidazol etc.).

35

Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.

40 Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegenwart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

45

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt verwendet werden Triethylamin und Pyridin.

5

Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare

10 aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

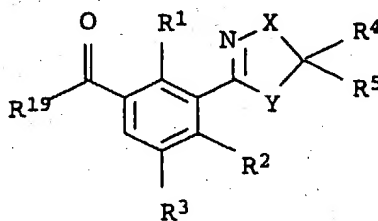
In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis
15 zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin erfolgen.

20 Die als Ausgangsmaterialien verwendeten Pyrazole der Formel II (mit Z = H) sind bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (z.B. EP-A 240 001 und J. Prakt. Chem. 315, 383 (1973)).

25 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel III sind neu,

30



III

35

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben.

R¹, R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy,
40 C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkyl-
sulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl
oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

R³ Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Alkyl;

45

- R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkoxy)-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, [2,2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-hydrazino-1]-C₁-C₄-alkyl,
- 5 C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Hydroxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, COR⁶, Phenyl oder
- 10 Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
- 15 C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

oder

- R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
- 20

25 oder

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

- 30 R⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;

R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

35

R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

40 Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

- R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxycarbonyl oder
- 45 CONR⁷R⁸;

oder

5 R^4 und R^9 oder R^4 und R^{10} oder R^5 und R^{12} oder R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

R^{19} Hydroxy oder abhydrolysierbarer Rest;

10

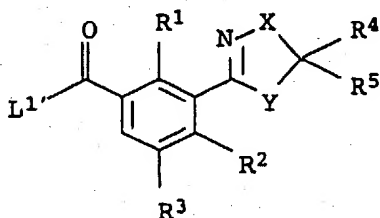
mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, 2-Chlor-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 2,4-Dichlor-3-(5-methylcarbonyloxy-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-benzoesäure-
15 methylester.

Beispiele für abhydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthio-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino, Imino-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können etc.

20

Bevorzugt sind 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoesäurehalogenide der Formel IIIa', mit $L^{1'}$ = Halogen (\cong III mit R^{19} = Halogen),

25



30

IIIa'

35 wobei die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

$L^{1'}$ Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet.

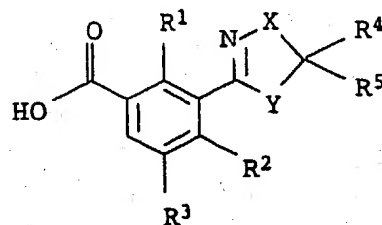
40

45

110

Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoessäuren der Formel III β (\cong III mit R¹⁹ = Hydroxy),

5



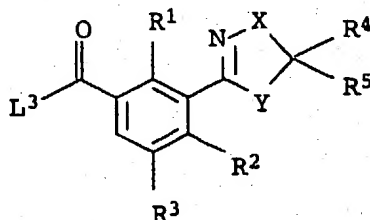
10

III β

wobei die Variablen R¹ bis R⁵, X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben.

15 Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoessäure-ester der Formel III γ (\cong III mit R¹⁹ = C₁-C₆-Alkoxy),

20



25

III γ

wobei die Variablen R¹ bis R⁵, X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

L³ C₁-C₆-Alkoxy bedeutet.

30

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoessäurederivate der Formel III in Bezug auf die Variablen R¹ bis R⁵, X und Y entsprechen denen der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I.

35

Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurederivate der Formel III, in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

40 R¹

Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylthio oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl;
insbesondere Chlor, Methyl, Methylthio oder Methylsulfonyl;
außerordentlich bevorzugt Chlor;

45

111

- R²** Wasserstoff, Nitro, Halogen, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl;
insbesondere Wasserstoff, Nitro, Chlor, Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;
- 5** außerordentlich bevorzugt Wasserstoff, Chlor, Methylthio, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;
- R³** Wasserstoff;
- 10** **R⁴, R⁵** Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Hydroxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkylthio oder COR⁶;
insbesondere Wasserstoff, Fluor, Methyl, Ethyl, Propyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, 2-Chloreth-1-yl, Methoxy, Ethoxy, 2-Methylprop-1-oxy, Hydroxy, Methylcarbonyloxy, Ethylthio, Formyl, Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl;
außerordentlich bevorzugt Wasserstoff, Fluor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, 2-Chloreth-1-yl, Methoxy, Ethoxy, 2-Methylprop-1-oxy, Hydroxy, Methylcarbonyloxy, Ethylthio, Formyl, Methylcarbonyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl;
- 15** **20** **25** oder
- R⁴ und R⁵** bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis mehrfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
insbesondere 1,4-Butdiyl, 2-Oxo-1,5-pentdiyl;
- 30** oder
- 35** **R⁴ und R⁵** bilden gemeinsam mit den zugehörigen Kohlenstoffen eine Carbonylgruppe;
- R⁶** Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- 40** insbesondere Wasserstoff, Methyl, Methoxy oder Ethoxy;
- X** O, S, CO, CR¹⁰R¹¹;
- Y** O, S, CR¹³R¹⁴;
- 45**

112

R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl;
insbesondere Wasserstoff, Methyl, Chlormethyl oder Methoxycarbonyl;

5

oder

R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis mehrfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
insbesondere 1,3-Propdiyl;

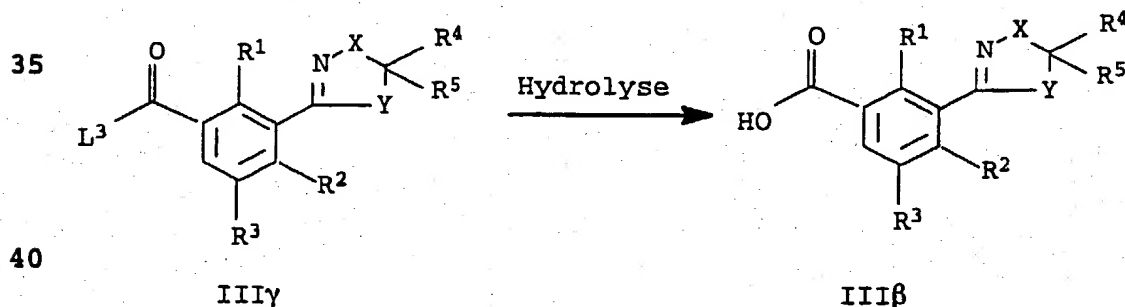
15 R^{19}

Hydroxy, Halogen oder C_1 - C_6 -Alkoxy;
insbesondere Hydroxy, Chlor, Methoxy oder Ethoxy;

mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester, 2-Chlor-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester und 2,4-Dichlor-3-(5-methylcarbonyloxy-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-benzoesäuremethylester.

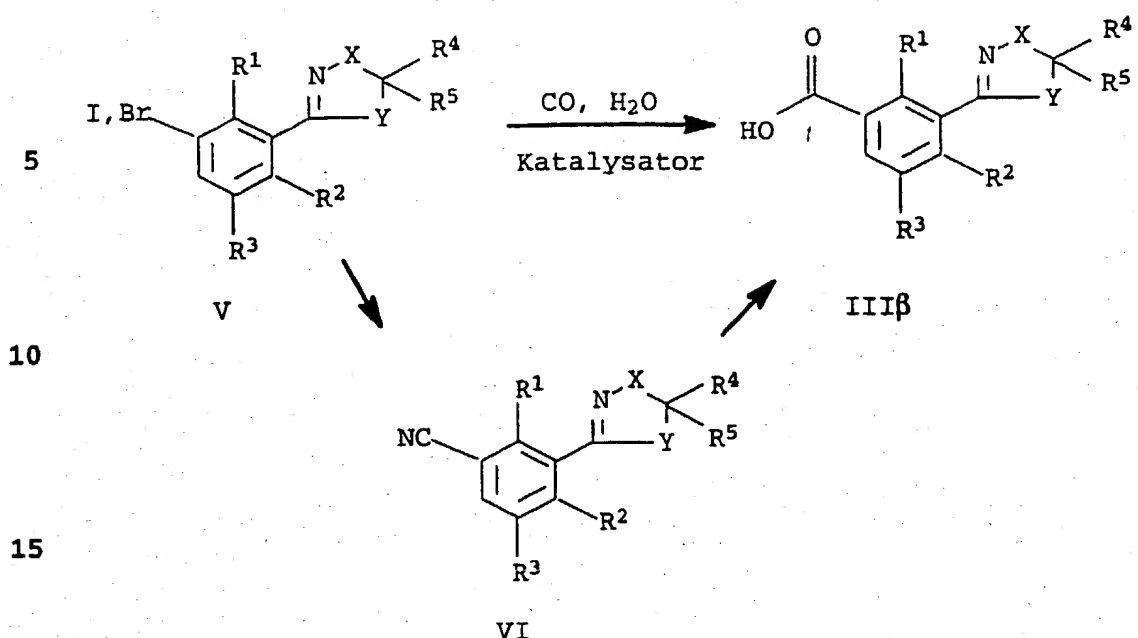
Die Benzoylhalogenide der Formel III α' (mit $L^1 = Cl, Br,$) können auf an sich bekannte Art und Weise durch Umsetzung der Benzoesäuren der Formel III β mit Halogenierungsreagentien wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Oxalylchlorid, Oxalylbromid hergestellt werden.

Die Benzoesäuren der Formel III β können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel III γ ($L^3 = C_1$ - C_6 -Alkoxy) hergestellt werden.



Ebenso können die Benzoesäuren der Formel III β durch Umsetzung von entsprechenden Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V, in Gegenwart eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetallkatalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter erhöhtem Druck erhalten werden.

113



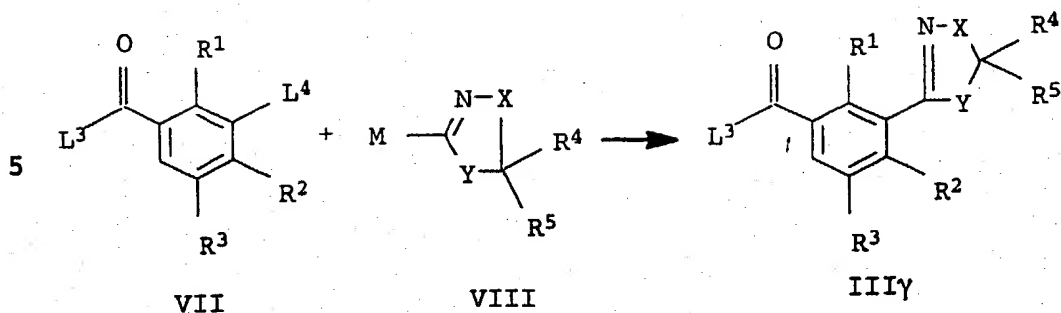
Weiterhin ist es möglich durch Rosenmund-von Braun-Reaktion
 20 Verbindungen der Formel V in die entsprechenden Nitrile der
 Formel VI zu überführen (vgl. z.B. Org. Synth. Bd III, 212
 (1955)) und diese durch nachfolgende Verseifung in die
 Verbindungen der Formel IIIβ umzuwandeln.

25 Die Ester der Formel IIIγ können durch Umsetzung von Arylhalogen-
 verbindungen oder Arylsulfonaten der Formel VII, wobei L⁴ für
 eine Ausgangsgruppe wie Brom, Iod, Triflat, Fluorsulfonyloxy etc.
 steht, mit Heterocyclyl-Stannaten (Stille-Kupplungen), Heterocy-
 clyl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heterocyclyl-Zink-
 30 verbindungen (Negishi-Reaktion) VIII, wobei M entsprechend für
 Sn(C₁-C₄-Alkyl)₃, B(OH)₂, ZnHal (mit Hal = Chlor, Brom) etc.
 steht, auf an sich bekannte Art und Weise (vgl. z.B. Tetrahedron
 Lett. 27, 5269 (1986) in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-
 Übergangsmetallkatalysator und gegebenenfalls einer Base erhalten
 35 werden.

40

45

114

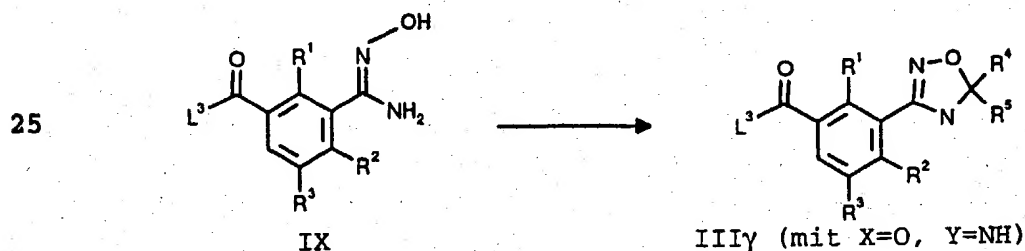


10 (mit $L^4 = \text{Br}, \text{J}, \text{OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) (mit $\text{M} = \text{Sn}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl})_3, \text{B}(\text{OH})_2, \text{ZnHal}$, wobei Hal für Cl oder Br steht)

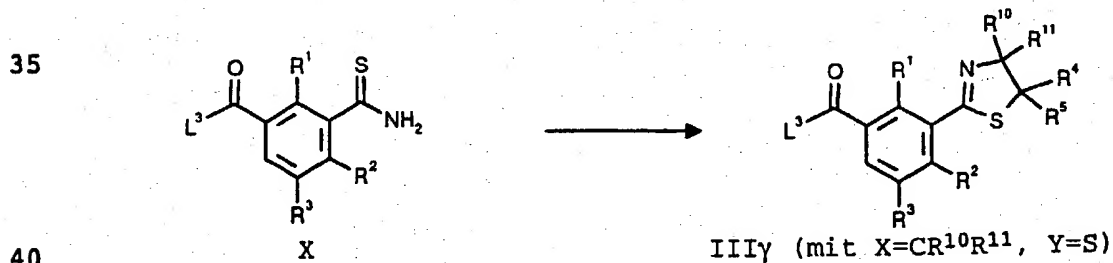
15 Ebenso ist es möglich, Ester der Formel IIIy durch Aufbau des in 3-Position gebundenen Heterocycluses zu erhalten.

Beispielsweise können aus Amidoximen der Formel IX durch Kondensation mit Aldehyden oder Ketonen 1,2,4-Oxadiazolin-3-yl-Derivate

20 (IIIy mit $\text{X}=\text{O}, \text{Y}=\text{NH}$) hergestellt werden (vgl. z.B. Arch. Phar. 326, 383-389 (1993)).

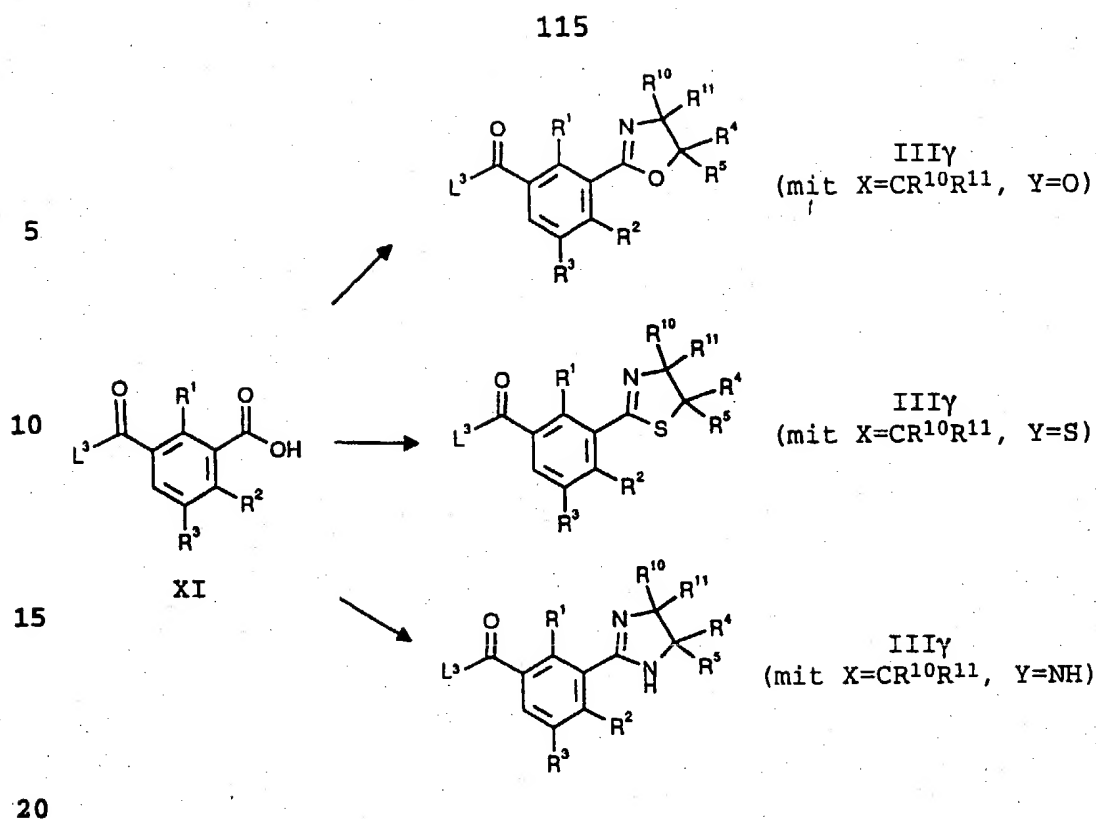


30 Die Thioamide der Formel X sind geeignete Vorprodukte für 2-Thiazolinyl-Derivate I (mit $\text{X}=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}, \text{Y}=\text{S}$) (vgl. z.B. Tetrahedron 42, 1449-1460 (1986)).

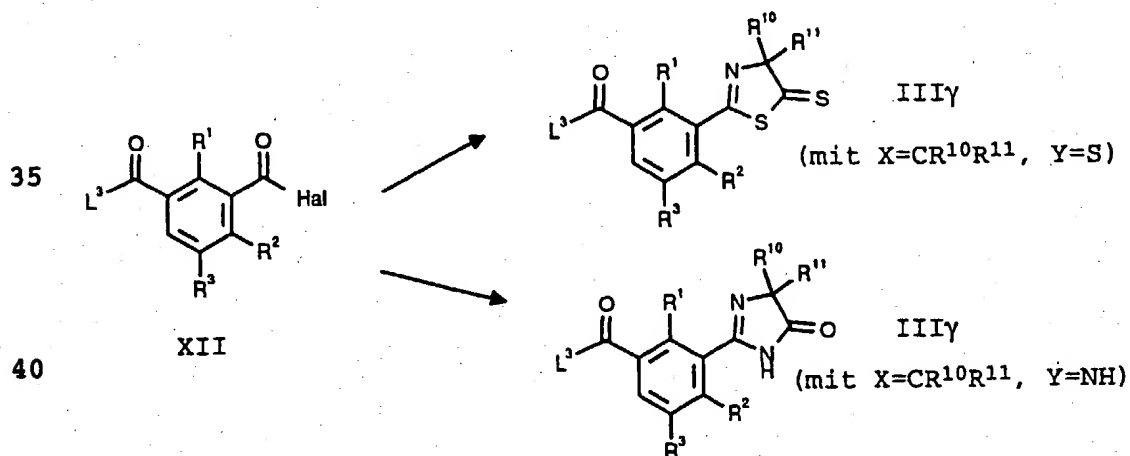


Aus den Carbonsäuren der Formel XI sind 2-Oxazolinyl-, 2-Thiazolinyl- und 2-Imidazolinyl-Derivate (IIIy mit $\text{X}=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}, \text{Y}=\text{O}$ bzw. $\text{Y}=\text{S}$ bzw. $\text{Y}=\text{NH}$) zugänglich (vgl. z.B. Tetrahedron Let. 22,

45 4471-4474 (1981)).



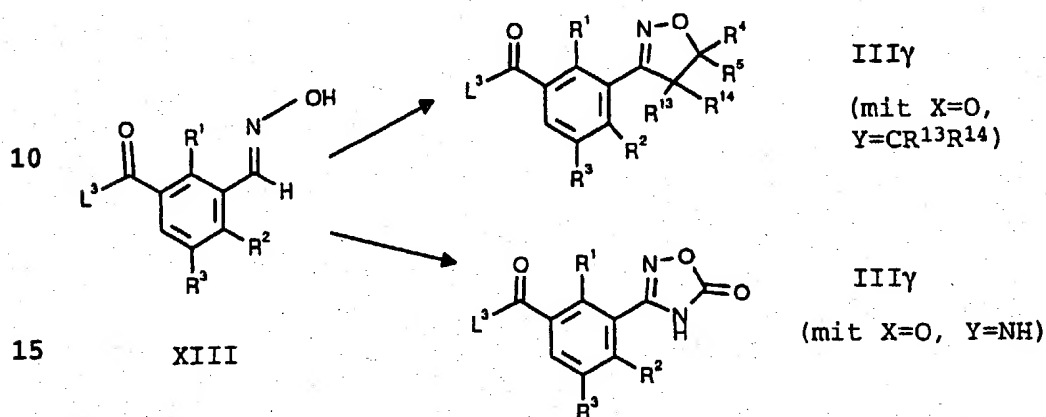
Nach literaturbekannten Verfahren können aus Carbonsäurehalo-
 25 geniden der Formel XII, wobei Hal für Halogen steht, insbesondere
 aus Carbonsäurechloriden, 1,3-Thiazol-5(4H)-thion-2-yl- (vgl.
 z.B. Helv. Chim. Acta, 69, 374-388 (1986)) und 5-Oxo-2-
 imidazolin-2-yl-Derivate (vgl. z.B. Heterocycles 29, 1185-1189
 (1989)) (III mit $X=CR^{10}R^{11}$, $Y=S$ bzw. $Y=NH$) hergestellt werden.
 30



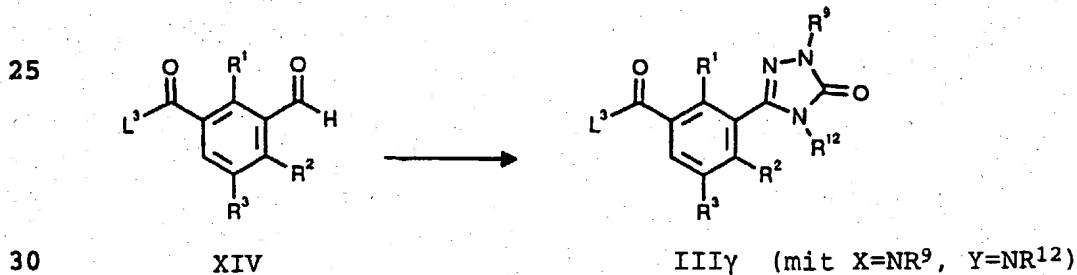
Die Umwandlung von Oximen der Formel XIII in 4,5-Dihydro-
 45 isoxazol-3-yl-Derivate (mit IIIy mit $X=O$, $Y=CR^{13}R^{14}$) kann in an
 sich bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäure-
 chloride XIV erfolgen. Aus letzteren werden in situ Nitriloxide

116

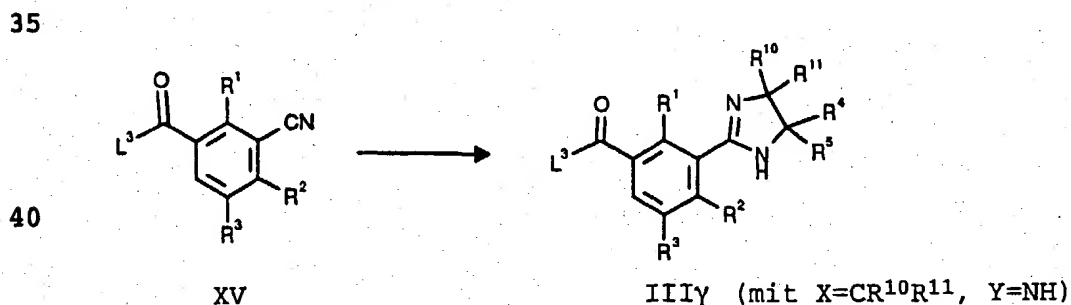
erzeugt, die mit Alkenen zu den gewünschten Produkten abreagieren (vgl. z.B. Chem. Ber. 106, 3258-3274 (1973)). 1,3-Dipolare Cycloadditionen von Chlorsulfonylisocyanat an Nitriloxide liefern 1,2,4-Oxadiazolin-5-on-3-yl-Derivate (IIIy mit X=O, Y=NH) (vgl. z.B. Heterocycles 27, 683-685 (1988)).



Die Aldehyde der Formel XIV können über die Zwischenstufe der Semicarbazone in 2,4-Dihydro-1,2,4-triazol-3-on-5-yl-Derivate (IIIy mit X=NR⁹, Y=NR¹²) umgewandelt werden (vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 23, 881-883 (1986)).

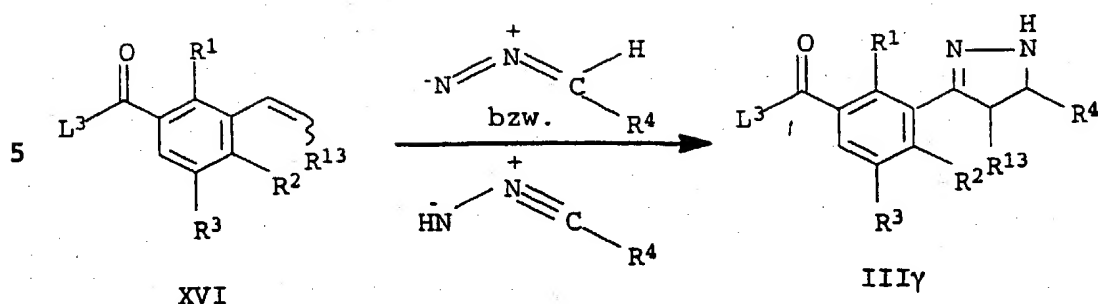


2-Imidazoliny-Derivate (IIIy mit X=CR¹⁰R¹¹, Y=NH) sind auch aus Benzonitrilen der Formel XV nach bekannten Methoden (vgl. z.B. J. Org. Chem. 52, 1017-1021 (1987)) herzustellen.



Mittels 1,3-dipolarer Cycloaddition von Diazoalkanen bzw. Nitril-
iminen mit Arylalkenen der Formel XVI können 3-Pyrazoliny-Derivate (IIIy mit X=NH, Y=CHR¹³) dargestellt werden.

117

(mit X=NH, Y=CHR¹³)

10

Die als Ausgangsverbindungen verwendeten Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V können in Analogie zu literaturbekannten Methode, z.B. durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrerseits durch Reduktion geeigneter Nitroverbindungen synthetisiert werden. Die Brom-substituierten Verbindungen der Formel V können außerdem durch direkte Bromierung geeigneter Edukte erhalten werden (vgl. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)).

20

Die Nitrile der Formel VI können wie oben beschrieben erhalten werden. Ebenso ist es möglich, diese aus entsprechenden Anilinen mittels Sandmeyer-Reaktion darzustellen.

25 Die Ausgangsverbindungen der Formel VII sind bekannt (vgl. z.B. Coll. Czech. Chem. Commun. 40, 3009-3019 (1975)) oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

30 Beispielsweise können die Sulfonate VII ($L^4 = \text{OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP-A 195 247) oder nach bekannten Methoden hergestellt werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).

35 Die Halogenverbindungen VII ($L^4 = \text{Cl}, \text{Br}$ oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen der Formel XIX erhalten werden.

Die Amidoxime der Formel IX, die Thioamide der Formel X und die Carbonsäuren der Formel XI können auf an sich bekannte Art und Weise aus den Nitrilen der Formel XV dargestellt werden.

Weiterhin ist es möglich, die Carbonsäuren der Formel XI aus den Aldehyden der Formel XIV nach bekannten Verfahren herzustellen (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Auflage, S. 629 ff, Wiley-Interscience Publication (1985)).

45

Die Carbonsäurehalogenide der Formel XII können in Analogie zu Standardverfahren aus den entsprechenden Carbonsäuren der Formel XI erhalten werden.

- 5 Die Oxime der Formel XIII erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in an sich bekannter Weise Aldehyde der Formel XIV mit Hydroxylamin umsetzt (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)).
- 10 Die Aldehyde der Formel XIV sind bekannt oder in Analogie zu bekannten Verfahren darstellbar. So können sie aus Methylverbindungen der Formel XVII durch Bromierung, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, und anschließende Oxidation dargestellt werden (vgl. Synth. Commun. 22, 1967 - 1971 (1992)).

Die Umwandlung der Oxime der Formel XIII in Nitrile der Formel XV kann ebenfalls nach an sich bekannten Verfahren erfolgen (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 931-932, Wiley-Interscience Publication (1985)).

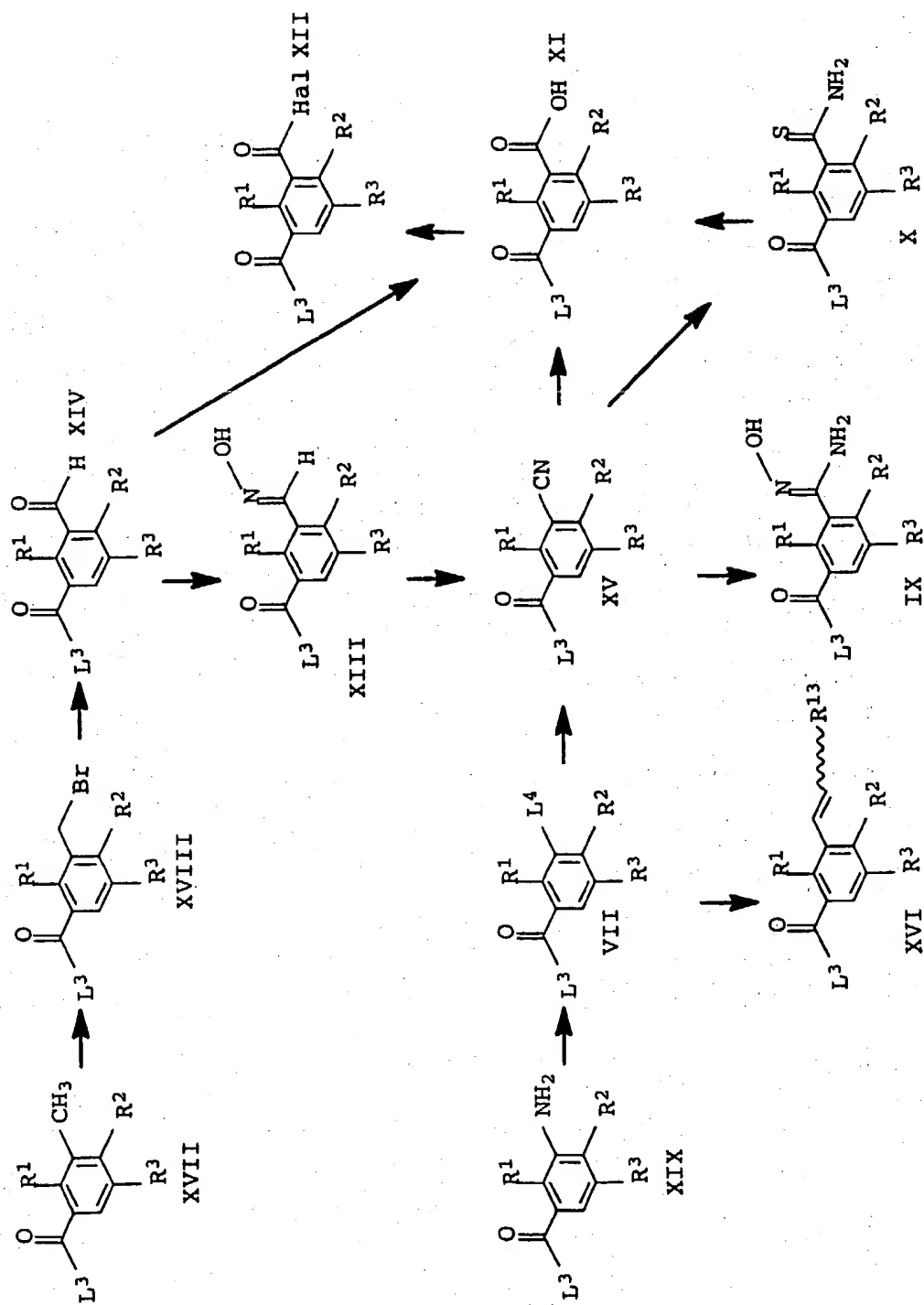
- Ausgehend von den Halogenverbindungen oder Sulfonaten der Formel VII ($L^4 = \text{Br}, \text{Cl}, \text{OSO}_2\text{CF}_3, \text{OSO}_2\text{F}$) lassen sich u.a. durch Heck-Reaktion mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators
- 25 Arylalkene der Formel XVI darstellen (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Press, London 1985; Synthesis 1993, 735 - 762).

30

35

40

45



Herstellungsbeispiele:

4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol (Verbindung 3.35)

Zu einer Lösung von 12,74 g (0,13 mol) 5-Hydroxy-1-methyl-pyrazol und 300 ml wasserfreiem Dioxan wurden unter Schutzgasatmosphäre bei Raumtemperatur gleichzeitig 43,60 g (0,13 mol)

- 10 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-chlorid in 375 ml wasserfreiem Dioxan und 13,56 g (0,134 mol) Triethylamin in 375 ml wasserfreiem Dioxan getropft. Nach 2 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Reaktionsgemisch über Kieselgel abfiltriert und mit Dioxan nachgewaschen. Das Eluat
- 15 wurde am Vakuum auf ca. 500 ml eingeeengt und mit 17,94 g (0,13 mol) getrocknetem, fein gepulvertem Kaliumcarbonat versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert und der Rückstand in ca. 700 ml Wasser aufgenommen. Unlösliche Bestandteile wurden abfiltriert und der pH-Wert des
- 20 Filtrats durch langsame Zugabe von 10 %iger Salzsäure auf pH = 2 - 3 eingestellt. Der sich bildende Niederschlag wurde abgesaugt. Man erhielt 46,16 g (92 % d. Th.) 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol.
- 25 (Fp. > 250°C)

In Tabelle 3 sind neben der voranstehenden Verbindung noch weitere 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoylderivate der Formel I aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder

- 30 herstellbar sind (falls die Endprodukte beim Ansäuern mit 10 %iger Salzsäure nicht ausgefallen sind, wurden sie mit Essigsäureethylester oder Dichlormethan extrahiert; anschließend wurde die organische Phase getrocknet und am Vakuum eingeeengt):

35

40

45

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|----------------------------------|-----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|--|
| 3.7 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 70 - 75 |
| 3.8 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 65 - 70 |
| 3.9 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 230 - 235 |
| 3.10 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 210 - 215 |
| 3.11 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 95 - 100 |
| 3.12 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 70 - 75 |
| 3.13 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.14 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 1,24(2d); 1,53(t); 2,52(m); 3,05(dd); 3,29(s); 3,52(dd); 3,73(d); 4,24(q); 5,05(m); 7,49(s); 7,66(d); 8,18(d). |
| 3.15 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,96(t); 1,53(d); 1,68(t); 1,95(sext); 3,07(dd); 3,32(s); 3,58(dd); 3,86(quant); 4,15(t); 5,03(m); 7,46(d); 7,64(d); 8,18(d). |
| 3.16 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 225 |
| 3.17 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 82 - 86 |
| 3.18 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 70 - 75 |
| 3.19 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | H | H | 68 - 73 |
| 3.20 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | H | H | 45 - 50 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|-------------------------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|--|
| 3.21 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 225 |
| 3.22 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 170 - 175 |
| 3.23 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 65 - 70 |
| 3.24 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | H | H | 55 - 60 |
| 3.25 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | H | H | 58 - 63 |
| 3.26 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.27 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₄ H ₉ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,94(t); 1,19(d); 1,22(t); 1,38(m); 1,74(br); 1,91(m); 2,53(m); 3,26(s); 4,45(t); 3,76(d); 4,18(t); 4,62(t); 7,45(s); 7,64(d); 8,16(d). |
| 3.28 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 0,96(d); 1,21(d); 2,33(m); 2,51(m); 3,28(s); 3,44(t); 3,75(d); 3,99(d); 4,61(t); 7,45(s); 7,66(d); 8,17(d). |
| 3.29 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | i-C ₄ H ₉ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 0,97(d); 1,66(t); 2,36(m); 3,29(s); 3,43(t); 3,82(q); 3,99(d); 4,60(t); 7,47(s); 7,68(d); 8,18(d). |
| 3.30 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,78(q); 3,92(s); 3,63(t); 7,46(s); 7,62(d); 8,17(d). |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|--|----------------|---|-----------------|-----------------|-----------------|---------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.31 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | i-C ₄ H ₉ SO ₂ | H | 1,23(d); 2,53(m), 3,28(s); 3,43(t); 3,70(d); 3,91(s); 4,61(t); 7,48(s); 7,66(d); 8,18(d). |
| 3.32 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | n-C ₃ H ₇ | H | H | 119 - 121 |
| 3.33 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | CH ₃ | 115 - 117 |
| 3.34 | Cl | NO ₂ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 217 - 218 |
| 3.35 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | > 250 |
| 3.36 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 125 - 128 |
| 3.37 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | n-C ₃ H ₇ SO ₂ | H | 78 - 83 |
| 3.38 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ SO ₂ | H | 1,52(t); 1,68(t); 3,29(s); 3,43(t); 3,82(q); 4,24(g); 4,63(t); 7,48(s); 7,65(d); 8,07(d). |
| 3.39 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | > 200 |
| 3.40 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 220 - 223 |
| 3.41 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | > 230 |
| 3.42 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 1,12(t); 1,53(d); 1,76(quin); 3,18(dd); 3,38(t); 3,55(dd); 3,73(s); 5,04(m); 5,55(s,br.); 7,37(s); 7,68(d); 8,13(d). |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------------|----------------|--|----------------|----------------------------------|------------------------------------|--------------------------------------|-----------------|-------------------------------|------------------------------|-----------------|---|
| 3.43 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,07(t); 1,50(m); 1,78(quin); 3,07(dd); 3,39(t); 3,55(dd); 4,12(t); 5,08(m); 7,38(s); 7,69(d); 8,11(d). |
| 3.44 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | |
| 3.45 a) | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | 1,33(s); 3,40(s); 4,17(s); 7,43(s); 7,79(d); 8,04(d). |
| 3.46 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | Na ⁺ | H | 218 - 220 |
| 3.47 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | K ⁺ | H | 193 |
| 3.48 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | Li ⁺ | H | > 230 |
| 3.49 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | NH ₄ ⁺ | H | 170 - 175 |
| 3.50 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | Na ⁺ | H | > 240 |
| 3.51 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | K ⁺ | H | 206 - 214 |
| 3.52 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | Li ⁺ | H | > 240 |
| 3.53 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | NH ₄ ⁺ | H | |
| 3.54 a) | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | C ₂ H ₅ | H | H | 1,27(t); 1,36(s); 3,41(q); 4,01(q); 4,18(s); 7,47(s); 7,83(d); 8,07(d). |
| 3.55 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ CH- | | C ₂ H ₅ | H | H | 99-104 |
| 3.56 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ CH- | | CH ₃ | H | H | 95-100 |
| 3.57 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 230-235 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|--|----------------|----------------------------------|---|-------------------------------|----------------------|-------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.58 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 190-195 |
| 3.59 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 95-100 |
| 3.60 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | < 230 |
| 3.61 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 198-200 |
| 3.62 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 215-218 |
| 3.63 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 213-215 |
| 3.64 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 186-190 |
| 3.65 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 84-86 |
| 3.66 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 90-95 |
| 3.67 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 70-75 |
| 3.68 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 50-55 |
| 3.69 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OCH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 3,18-3,99(1H); 5,78(1H); 7,50(1H); 7,81(1H); 8,09(1H). |
| 3.70 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₂ Cl | CH ₃ | H | H | 1,52(3H); 3,30-4,12(8H); 4,36(1H); 4,93(1H); 7,49(1H); 7,81(1H); 8,09(1H). |
| 3.71 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₂ Cl | C ₂ H ₅ | H | H | 1,27(3H); 1,55(3H); 3,28-4,02(7H); 4,37(1H); 4,92(1H); 7,48(1H); 7,80(1H); 8,07(1H). |
| 3.72 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | 132-135 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|-----------------|--|----------------|----------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|-----------------|-------------------------------|----------------|-----------------|---|
| 3.73 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 95-100 |
| 3.74 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,16(3H); 1,27(3H); 3,20-4,00(9H); 5,89(1H); 7,50(1H); 7,82(1H); 8,07(1H). |
| 3.75 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | K ⁺ | H | 200-205 |
| 3.76 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | CH ₃ | H | H | 120-123 |
| 3.77 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 152-158 |
| 3.78 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 172-176 |
| 3.79 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 188-205 |
| 3.80 | Cl | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,29(t); 2,56(s); 3,28(t); 3,93(q); 4,49(t); 7,40(s); 7,43(d); 7,55(d). |
| 3.81 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₂ Cl | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 78-82 |
| 3.82 | CH ₃ | H | H | CH ₂ | H | H | S | C ₂ H ₅ | H | H | 1,44(t); 2,50(s); 3,49(t); 4,09(q); 4,53(t); 7,35(m); 7,48(d); 7,62(d). |
| 3.83 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₂ Cl | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 81-85 |
| 3.84 | Cl | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 151-153 |
| 3.85 | Cl | SOCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,28(t); 2,82(s); 3,40(m); 3,92(m); 4,52(t); 7,45(s); 7,82(d); 8,10(d). |
| 3.86 | CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 205-210 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|-------|-----------------|---------------------------------|----------------|-----------------|--------------------------------|----------------|-------------------|-------------------------------|---|-----------------|---|
| 3.87 | Cl | Cl | H | CH ₂ | H | H | S | C ₂ H ₅ | H | H | 173-179 |
| 3.88 | Cl | SCH ₃ | H | CH ₂ | H | H | S | C ₂ H ₅ | H | H | 1,43(t); 2,51(s); 3,59(t); 4,08(q); 4,51(t); 7,22(d); 7,41(s); 7,50(d). |
| 3.89 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | S | C ₂ H ₅ | H | H | 1,50(t); 3,28(s); 3,62(t); 4,10(q); 4,49(t); 7,36(s); 7,68(d); 8,19(d). |
| 3.90 | CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 174-180 |
| 3.91 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₂ Cl | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 77-83 |
| 3.92 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | |
| 3.93 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | |
| 3.94 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | F | CH ₂ | CH ₃ | H | H | |
| 3.95 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | F | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | |
| 3.96 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | C ₂ H ₅ | H | H | 183-184 |
| 3.97 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 223-225 |
| 3.98 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 183-184 |
| 3.99 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 195-196 |
| 3.100 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 199-200 |
| 3.101 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | CH ₃ | H | H | 230-233 |
| 3.102 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHCl(CH ₃) | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 102-107 |
| 3.103 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHCl(CH ₃) | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 80-85 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ⁶ | Z | R ¹⁸ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|-------|---------------------------------|---------------------------------|----------------|---|---------------------------------|----------------|-----------------|-------------------------------|--|-----------------|---|
| 3.104 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | n-C ₃ H ₇ | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | |
| 3.105 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | n-C ₃ H ₇ | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | |
| 3.106 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | ⁺ NH ₂ (CH ₃) ₂ | H | 200 |
| 3.107 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | ⁺ NH ₂ (CH ₂ CH ₂ OH) | H | 187 |
| 3.108 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | ⁺ NH ₃ (CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OH) | H | 180 |
| 3.109 | SCH ₃ | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | 2,33(s); 2,51(s); 3,40(t); 3,70(s); 4,58(t); 5,15(bris); 7,21(s); 7,31(d); 7,42(d). |
| 3.110 | SCH ₃ | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | 1,38(t); 2,33(s); 2,49(s); 3,41(t); 4,10(q); 4,58(t); 7,25(s); 7,32(d); 7,41(d); 7,82(bris). |
| 3.111 | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | CH ₃ | H | H | Öl |
| 3.112 | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | C ₂ H ₅ | H | H | Öl |

a) Hergestellt aus 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid mit zwei Äquivalenten Kaliumcarbonat

Nachfolgend sind die Synthesen einiger Ausgangsstoffe aufgeführt:

2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-
5 chlorid (Verbindung 4.5)

Stufe a) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon

10 Zu einer Suspension von 286 g (2,14 mol) Aluminiumtri-
chlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan wurde bei 15-20°C
eine Lösung von 157 g (2 mol) Acetylchlorid in 420 ml
1,2-Dichlorethan getropft. Anschließend wurde eine Lösung
von 346 g (2 mol) 2-Chlor-6-methylthio-toluol in 1 l
1,2-Dichlorethan zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren wurde
15 das Reaktionsgemisch in eine Mischung aus 3 l Eis und 1 l
konz. HCl gegossen. Es wurde mit Methylenchlorid extra-
hiiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit
Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand
wurde im Vakuum destilliert. Man erhielt 256 g (60 %
20 d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-thio-acetophenon.
(Fp.: 46°C)

Stufe b) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon

25 163,0 g (0,76 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-aceto-
phenon wurden in 1,5 l Eisessig gelöst, mit 18,6 g
Natriumwolframat versetzt und unter Kühlung 173,3 g
30 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Es wurde
2 Tage nachgerührt und anschließend mit Wasser verdünnt.
30 Der ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser
gewaschen und getrocknet. Man erhielt 164,0 g (88 %
d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon.
(Fp.: 110-111°C)

35 Stufe c) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure

82 g (0,33 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-aceto-
phenon wurden in 700 ml Dioxan gelöst und bei Raum-
temperatur mit 1 l einer 12,5 %igen Natriumhypochlorit-
40 lösung versetzt. Anschließend wurde 1 Stunde bei 80°C
nachgerührt. Nach dem Abkühlen bildeten sich zwei Phasen,
von denen die untere mit Wasser verdünnt und schwach
angesäuert wurde. Der ausgefallene Feststoff wurde
abgesaugt, mit Wasser nachgewaschen und getrocknet. Man
45 erhielt 60 g (73 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-
sulfonyl-benzoesäure.
(Fp.: 230-231°C)

Stufe d) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

100 g (0,4 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure wurden in 1 l Methanol gelöst, und bei Rückfluß-
temperatur 5 Stunden mit Chlorwasserstoff begast.
Anschließend wurde eingeeengt. Man erhielt 88,5 g (84 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.
(Fp.: 107-108°C)

10

Stufe e) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

15

82 g (0,31 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester werden in 2 l Tetrachlormethan gelöst und unter Belichtung portionsweise mit 56 g (0,31 mol) N-Bromsuccinimid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert, das Filtrat eingeeengt und der Rückstand in 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die Lösung wurde mit Petrolether versetzt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt und getrocknet. Man erhielt 74,5 g (70 % d.Th.) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.
(Fp.: 74-75°C)

25

Stufe f) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

30

Eine Lösung von 41,0 g (0,12 mol) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 250 ml Acetonitril wurde mit 42,1 g (0,36 mol) N-Methylmorpholin-N-oxid versetzt. Der Ansatz wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, anschließend eingeeengt und der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen. Die Lösung wurde mit Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 31,2 g (94 % d.Th.) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester
(Fp.: 98-105°C)

35

Stufe g) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure

40

15,00 g (54 mmol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 4,20 g (60 mmol) Hydroxylaminhydrochlorid wurden in 300 ml Methanol aufgenommen und eine Lösung von 3,18 g (30 mmol) Natriumcarbonat in 80 ml Wasser zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Methanol abdestilliert, der Rückstand mit Wasser verdünnt und mit Diethylether extrahiert. Nach

45

132

Trocknen der organischen Phase wurde das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt 14,40 g (91 % d.Th.)

2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

5 (Fp.: 126-128°C).

Stufe h) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.3)

10 In eine Lösung von 158,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Dichlormethan wurde bei 15-20°C 30 Minuten lang Ethylen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natriumacetat wurden 454 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei 10°C unter

15 gleichzeitiger Ethylen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Ethylen bei 10°C eingeleitet. Nach 12 Stunden Rühren wurden die Phasen getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 156,5 g (90 % d.Th.)

20 2-Chlor-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d)).

25 Stufe i) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.4)

30 Zu einem Gemisch von 170,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Methanol wurde bei 40-45°C langsam eine Lösung von 32,8 g Natriumhydroxid gelöst in 330 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 5 Stunden bei

35 50°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels nahm man den Rückstand in 1,5 l Wasser auf und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 148,8 g

40 (91 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure.

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,26 (s); 3,45 (t); 4,63 (t); 8,15 (s); 8,53 (s, br)).

45

133

Stufe j) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.5)

5 Zu einer Lösung von 139,0 g 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 1 l trockenem Toluol wurden bei 50°C 74,8 g (0,63 mol) Thionylchlorid in 50 ml trockenem Toluol getropft. Nach 6 Stunden Erhitzen auf 110°C wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid in 10 quantitativer Ausbeute.
(¹H-NMR (δ in ppm): 3,25 (s); 3,46 (t); 4,62 (t); 8,21 (dd)).

15 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.39)

Stufe a) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.25)

20 In eine Lösung von 15,0 g (52 mmol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 200 ml Dichlormethan wurde bei Raumtemperatur 30 Minuten lang Propen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natriumacetat wurden 42,8 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei 25 Raumtemperatur unter gleichzeitiger Propen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Propen bei Raumtemperatur eingeleitet. Nach 3 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, nochmals 5 Stunden unter Rückfluß Propen ein- 30 geleitet und wiederum 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach Trennung der Phasen wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 15,5 g (89 % d.Th.) 2-Chlor-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester. 35
(Fp.: 130-135°C).

40 Stufe b) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.26)

45 Zu einem Gemisch von 15,00 g (45 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 200 ml Methanol wurde langsam eine Lösung von 3,52 g (88 mmol) Natriumhydroxid gelöst in 100 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 48 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach Abdestillieren des

134

Lösungsmittels nahm man den Rückstand in Wasser auf und wusch die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 13,20 g (92 % d.Th.) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure. (Fp.: 173-178°C).

10

Stufe c) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.39)

15

Zu einer Lösung von 13,0 g (41 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 250 ml trockenem Toluol wurden bei Raumtemperatur 5,7 g (51 mmol) Thionylchlorid getropft. Anschließend wurde bis zur vollständigen Umsetzung unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 14,2 g 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylbenzoylchlorid in quantitativer Ausbeute.

20

2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid

25

Stufe a) 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

30

Zu einer Lösung von 115,3 g (0,42 mol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 2000 ml Acetonitril wurden bei 5°C nacheinander 13,8 g (0,11 mol) Natriumhydrogenphosphatmonohydrat in 170 ml Wasser, 49,3 g (0,43 mol) 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung und 66,2 g (0,59 mol) 80 %ige wäßrige Natriumchloritlösung gegeben. Die Reaktionslösung wurde anschließend 1 Stunde bei 5°C und 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde mit 10 %iger Salzsäure auf pH = 1 eingestellt und 1500 ml wäßrige 40 %ige Natriumhydrogensulfit-Lösung zugegeben. Nach 1 Stunde Rühren bei Raumtemperatur wurde die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Natriumhydrogensulfit-Lösung gewaschen und getrocknet. Nach Abdestillation des Lösungsmittels erhielt man 102,0 g 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

35

40

45

135

(¹H-NMR (δ in ppm): 3,34 (s); 3,93 (s); 8,08 (s); 14,50 (s, br.).)

5 Stufe b) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure-methylester

10 Zu einer Lösung von 6,0 g (0,021 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-carbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 50 ml trockenem Toluol wurden 2 Tropfen Dimethylformamid und 11,9 g (0,1 mol) Thionylchlorid gegeben. Die Lösung wurde 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Entfernen des Lösungsmittels am Vakuum erhielt man 6,2 g 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester. (d) 15 (¹H-NMR (δ in ppm): 3,21 (s); 4,02 (s); 8,02 (d); 8,07 (d).)

20 Stufe c) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbo-nyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

25 Zu einer Lösung von 4,54 g (50 mmol) 2,2-Dimethylethanol-amin in 40 ml Dichlormethan wurde bei 0-5°C eine Lösung von 7,80 g (25 mmol) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester getropft. Nach 6 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde die Reaktionslösung drei- mal mit Wasser extrahiert, getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 8,20 g (80 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'- dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure- methylester. (Fp.: 70-72°C).

30

Stufe d) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbo-nyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

35 Ein Gemisch aus 6,9 g (20 mmol) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 5 ml Thionylchlorid wurde 6 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Lösung wurde mit 50 ml Dichlormethan verdünnt und anschließend einge-engt. Der Rückstand wurde in 20 ml Dichlormethan gelöst. 40 Durch Zugabe von Cyclohexan bildete sich ein kristalliner Niederschlag, der abgesaugt und getrocknet wurde. Man erhielt 6,4 g (88 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-di-methylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure-methylester.

45

Stufe e) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.38)

5 Eine Lösung von 5,82 g (15 mmol) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 0,81 g (20 mmol) Natriumhydroxid in 80 ml Methanol rührte 8 Stunden bei Raumtemperatur. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde
10 der Rückstand in Wasser aufgenommen und dreimal mit Essigsäureethylester gewaschen. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Nach dem Trocknen der organischen Phase entfernte man das Lösungsmittel am Vakuum. Man erhielt
15 3,10 g (56 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure.
(¹H-NMR (δ in ppm): 1,34 (s); 3,40 (s); 4,13 (s); 8,07 (s); 13,95 (s, br)).

20 Stufe f) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid

Eine Lösung von 3,00 g (9 mmol) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure, 1,43 g Thionylchlorid und 1 Tropfen Dimethylformamid in 80 ml trockenem Toluol wurde 3 Stunden unter
25 Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert. Man erhielt 3,43 g (86 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid.

30 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.22)

35 Stufe a) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

40 In eine Lösung von 15,0 g (48 mmol) 2-Chlor-3-chlor-carbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 300 ml trockenem Dioxan wurde 2 Stunden lang Ammoniak geleitet. Der gebildete Niederschlag wurde abgesaugt und das Filtrat eingeeengt. Man erhielt 15,2 g 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in quantitativer Ausbeute.

45

137

Stufe b) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonfyl-benzoesäuremethylester

5 Zu einer Lösung von 4,37 g (15 mmol) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonfyl-benzoesäuremethylester in 150 ml trockenem Toluol wurden 9,80 g (75 mmol) Chlorcarbonylsulfenylchlorid getropft. Nach 48 Stunden Rühren unter Rückfluß wird das Lösungsmittel am Vakuum entfernt und der Rückstand am Kieselgel chromatographiert (Eluent: Essigsäureethylester/Cyclohexan = 1/1). Man erhielt 3,70 g (70 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonfyl-benzoesäuremethylester.

2-Chlor-4-methylsulfonfyl-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.41)

20 Zu 26,6 g (0,13 mol) 1-Amino-2-bromethan-Hydrobromid in 500 ml Toluol wurden bei Raumtemperatur 41,8 g (0,41 mol) Triethylamin und anschließend 31,1 g (0,10 mol) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonfylbenzoesäuremethylester in 150 ml Toluol getropft. Nach 5 Stunden Erhitzen unter Rückfluß und 12 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurden nochmals 5,0 g (0,02 mol) 1-Amino-2-bromethan-Hydrobromid zugegeben und 7,5 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wurde das Reaktionsgemisch mit Essigsäureethylester verdünnt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingengt. Der Rückstand wurde dann aus Methyl-tert.-butylether/Essigsäureethylester umkristallisiert. Man erhielt 14,5 g (46 % d.Th.) 2-Chlor-4-methylsulfonfyl-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-benzoesäuremethylester.

30 2-Chlor-3-(5-methoxy-5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonfyl-benzoesäure (Verbindung 4.60)

35 Stufe a) 2-Chlor-3-(5-methoxy-5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonfyl-benzoesäuremethylester

40 Zu 10,0 g (34 mmol) 2-Chlor-3-(hydroxyiminomethyl)-4-methylsulfonfyl-benzoesäuremethylester in 200 ml Methylenchlorid wurden nacheinander 7,3 g (102 mmol) 2-Methoxy-1-propen, 28 ml Natriumhypochloritlösung (12,5 %ig) und eine Spatelspitze Natriumacetat zugegeben. Nach 12 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Lösungsmittel entfernt, der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen, mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingengt. Der Rückstand wurde an Kieselgel (Eluent: Cyclohexan : Essigsäureethylester = 3:2) chromatographiert. Man erhielt 5,8 g (47 % d.Th.) 2-Chlor-3-(5-methoxy-5-

138

methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(Fp.: 100-105°C)

- 5 Stufe b) 2-Chlor-3-(5-methoxy-5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure

Zu 5,0 g (37,5 mmol) Lithiumiodid in 200 ml Pyridin wurden bei Rückflußtemperatur 5,5 g (15,0 mmol)

- 10 2-Chlor-3-(5-methoxy-5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 100 ml Pyridin getropft. Nach 4 Stunden Rühren bei dieser Temperatur wurde abgekühlt, das Lösungsmittel abdestilliert, der Rückstand in Toluol aufgenommen und wiederum eingeeengt.

- 15 Anschließend wurde mit Wasser versetzt, mit Methylenchlorid gewaschen und mit Salzsäure ein pH-Wert von 1 eingestellt. Nach Extraktion der wäßrigen Phase mit Methylenchlorid wurde die resultierende organische Phase getrocknet und eingeeengt. Man erhielt 4,7 g (90 % d.Th.)

- 20 2-Chlor-(5-methoxy-5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure.

(Fp.: 40-45°C)

- 2-Chlor-3-(2-methyl-2H-1,3,4-dioxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-
25 benzoessäuremethylester (Verbindung 4.44)

- Zu 8,0 g (27,4 mmol) 2-Chlor-3-(hydroxyiminomethyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 150 ml Methylenchlorid wurden 16,0 g (27,4 mmol) einer 12,5 %igen Natriumhypochloritlösung
30 getropft und eine Spatelspitze Natriumacetat zugegeben. Nach 1 Stunde wurden innerhalb von 36 Stunden in Portionen 34,4 g (0,74 mol) Acetaldehyd zugegeben und langsam bis auf 55°C erhitzt. Anschließend wurde 48 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde
35 dann in Methylenchlorid aufgenommen, 10,0 g (0,23 mol) Acetaldehyd und eine Spatelspitze Natriumacetat zugegeben und 8 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach 72 Stunden wurden nochmals 10,0 g (0,23 mol) Acetaldehyd zugegeben und bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit Wasser gewaschen, getrocknet und
40 eingeeengt. Der Rückstand wurde an Kieselgel (Eluent: Isopropanol : Cyclohexan = 1:9) eluiert. Man erhielt 5,0 g (55 % d.Th.)
2-Chlor-3-(2-methyl-2H-1,3,4-dioxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

In der nachfolgenden Tabelle 4 sind neben den voranstehend beschriebenen Verbindungen weitere Benzoessäurederivate der Formel III aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder herstellbar sind.

5

10

15

20

25

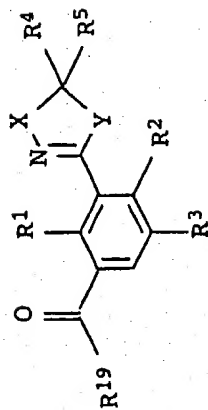
30

35

40

45

Tabelle 4:



| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---|----------------|----------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|------------------|---|
| 4.1 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 3,29 (t); 3,91 (s); 4,58 (t); 7,46 (d); 7,83 (d). |
| 4.2 | Cl | Cl | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,28 (t); 4,60 (t); 7,02 (s, br); 7,46 (d); 7,98 (d). |
| 4.3 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d). |
| 4.4 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,26 (s); 3,45 (t); 4,63 (t); 8,15 (s); 8,53 (s, br). |
| 4.5 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | Cl | 3,25 (s); 3,46 (t); 4,62 (t); 8,21 (dd). |
| 4.6 | Cl | Cl | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | OH | 1,31 (s); 4,16 (s); 7,69 (d); 7,90 (d); 13,8 (s, br). |
| 4.7 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,25 (t); 1,57 (s); 3,21 (s); 3,42 (q); 3,99 (s); 7,94 (d); 8,07 (d). |
| 4.8 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 1,13 (t); 1,47 (s); 3,15 (s); 3,43 (q); 8,06 (s); 13,8 (s, br). |
| 4.9 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,28 (t); 3,41 (m); 4,02 (s); 4,62 (t); 7,95 (d); 8,06 (d). |
| 4.10 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 137-140 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|--|----------------|-----------------|----------------------------------|-----------------|-----------------|------------------|--|
| 4.11 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,26 (t); 1,53 (d); 3,06 (dd); 3,42 (q); 3,49 (dd); 5,05 (m); 7,95 (d); 8,07 (d). |
| 4.12 | Cl | SO ₂ C ₂ H ₅ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 140-143 |
| 4.13 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OCH ₃ | 3,30 (s); 3,98 (s); 4,11 (t); 4,55 (t); 7,97 (d); 8,08 (d). |
| 4.14 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OH | 3,38 (s); 4,00 (t); 4,46 (t); 8,08 (s). |
| 4.15 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,30 (s); 3,35 (t); 4,15 (s, br); 4,50 (t); 8,05 (s). |
| 4.16 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 0,95 (t); 1,47 (s); 1,58 (quin); 3,12 (s); 3,31 (s); 3,43 (t); 3,93 (s); 8,09 (dd). |
| 4.17 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 0,93 (t); 1,47 (s); 1,58 (quin); 3,15 (s); 3,42 (t); 8,05 (s). |
| 4.18 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,92 (t); 1,55 (quin); 3,39 (m); 3,93 (s); 4,50 (t); 8,08 (dd). |
| 4.19 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 148-150 |
| 4.20 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,93 (t); 1,49 (d); 1,58 (quin); 2,94 (dd); 3,42 (m); 3,93 (s); 4,97 (m); 8,10 (dd). |
| 4.21 | Cl | SO ₂ -n-C ₃ H ₇ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 0,94 (t); 1,39 (d); 1,58 (quin); 2,96 (dd); 3,50 (m); 4,95 (m); 8,05 (s). |
| 4.22 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | S | =O | | O | OCH ₃ | 3,24 (s); 4,02 (s); 8,14 (dd). |
| 4.23 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 118-121 |
| 4.24 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OH | |
| 4.25 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 130-135 |
| 4.26 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | OH | 173-178 |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|----------------------------------|---|---------------------------------------|-----------------|------------------|--|
| 4.27 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,57 (s); 3,18 (s); 3,27 (s); 4,01 (s); 7,97 (d); 8,12 (d). |
| 4.28 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | CH ₃ | CH ₂ | OH | 1,48 (s); 3,15 (s); 3,34 (s); 8,08 (dd). |
| 4.29 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 0,97 (t); 1,72 (m); 3,10 (dd); 3,32 (s); 3,37 (dd); 4,72 (m); 8,08 (dd). |
| 4.30 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | | OCH ₃ | 1,57 (m); 1,81 (m); 2,21 (m); 3,20 (s); 4,02 (s); 4,32 (t); 5,35 (dd); 7,92 (d); 8,18 (d). |
| 4.31 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | -(CH ₂) ₃ -CH- | | OH | 1,72 (m); 2,01 (m); 3,27 (s); 4,24 (t); 5,23 (dd); 8,05 (d); 8,15 (d); 13,8 (s, br). |
| 4.32 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | OCH ₃ | 2,00 (m); 3,23 (s); 3,27 (s); 3,72 (m); 4,00 (s); 7,96 (d); 8,04 (d). |
| 4.33 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | | CH ₂ | OH | 78-83 |
| 4.34 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | OCH ₃ | 1,78 (m); 2,24 (m); 3,27 (s); 3,36 (s); 3,98 (s); 7,94 (d); 8,12 (d). |
| 4.35 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | -(CH ₂) ₄ - | | CH ₂ | OH | 1,76 (m); 2,05 (m); 3,30 (s); 3,33 (s); 8,09 (dd). |
| 4.36 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | OCH ₃ | 1,00 (t); 1,85 (m); 3,13 (s); 3,27 (s); 3,98 (s); 7,94 (d); 8,11 (d). |
| 4.37 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₂ | OH | 0,91 (t); 1,76 (m); 3,12 (s); 3,33 (s); 8,07 (dd); 13,75 (s, br). |
| 4.38 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | C(CH ₃) ₂ | H | H | O | OH | 1,34 (s); 3,40 (s); 4,13 (s); 8,07 (s); 13,95 (s, br). |
| 4.39 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CH ₂ | Cl | |
| 4.40 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OH | > 260 |
| 4.41 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | O | OCH ₃ | 3,29 (3H); 3,96 (3H); 4,12 (2H); 4,55 (2H); 7,98 (1H); 8,09 (1H). |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|----------------|---------------------------------|----------------|---|--------------------------------|----------------|-----------------------------------|------------------|---|
| 4.42 | Cl | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₃ | 202-203 |
| 4.43 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | COOMe | H | CHCO ₂ CH ₃ | OCH ₃ | 1,05 (3H); 1,35 (3H); 3,19 (3H); 4,01 (3H); 4,09 (2H); 4,35 (2H); 5,06 (1H); 5,77 (1H); 8,08 (1H); 8,17 (1H). |
| 4.44 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | O | OCH ₃ | 1,78 (3H); 3,30 (3H); 3,98 (3H); 6,40 (1H); 8,08 (1H); 8,15 (1H). |
| 4.45 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHO | H | CHCH ₃ | OCH ₃ | 80-85 |
| 4.46 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₂ Cl | OCH ₃ | 1,65 (3H); 3,27 (3H); 3,50 (2H); 4,00 (3H); 4,22 (1H); 4,88/5,08 (1H); 7,99 (1H); 8,12 (1H). |
| 4.47 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₂ Cl | OH | 100-105 |
| 4.48 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHO | H | CHCH ₃ | OH | 180-185 |
| 4.49 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,30 (3H); 2,75 (2H); 3,25 (1H); 3,34 (3H); 3,78 (1H); 3,94 (3H); 6,22 (1H); 8,15 (2H). |
| 4.50 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OH | 65-67 |
| 4.51 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | OCH ₃ | 1,01 (3H); 1,28 (3H); 3,33 (4H); 3,96 (3H); 4,98 (1H); 8,12 (1H); 8,20 (1H). |
| 4.52 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | OH | 68-75 |
| 4.53 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OCOCH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 105-110 |
| 4.54 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | |
| 4.55 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OCOCH ₃ | H | CH ₂ | OH | 45-50 |
| 4.56 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OCH ₃ | H | CH ₂ | OH | 60-65 |
| 4.57 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHCl(CH ₃) | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,63 (3H); 3,23 (3H); 3,50 (2H); 3,99 (3H); 4,25 (1H); 4,83/5,03 (1H); 7,96 (1H); 8,13 (1H). |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; 1H-NMR [δ in ppm] |
|------|-----------------|---------------------------------|----------------|-----------------|--------------------------------|--------------------|-----------------|------------------|--|
| 4.58 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CHCl(CH ₃) | H | CH ₂ | OH | 1,56 (3H); 3,33 (3H); 3,43 (2H); 4,36 (1H); 4,93 (1H); 8,10 (2H). |
| 4.59 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 100-105 |
| 4.60 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₂ | OH | 40-45 |
| 4.61 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | OCOCH ₃ | CH ₂ | OCH ₃ | 60-65 |
| 4.62 | Cl | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | |
| 4.63 | Cl | SO ₂ Me | H | O | COCH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 2,36 (3H); 3,25 (3H); 3,66 (2H); 4,01 (3H); 5,20 (1H); 8,01 (1H); 8,12 (1H). |
| 4.64 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 156 |
| 4.65 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | H | CH ₂ | OH | 170 |
| 4.66 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | F | CH ₂ | OCH ₃ | |
| 4.67 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | F | CH ₂ | OH | |
| 4.68 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | H | CH ₂ | OCH ₃ | 142-143 |
| 4.69 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | F | H | CH ₂ | OH | |
| 4.70 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₂ Cl | H | CH ₂ | OCH ₃ | 107-110 |
| 4.71 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₂ Cl | H | CH ₂ | OH | 60-65 |
| 4.72 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OCH ₃ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 105-110 |
| 4.73 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | OC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 155-160 |
| 4.74 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | CH ₂ | H | H | S | OCH ₃ | |
| 4.75 | CH ₃ | H | H | C=O | H | H | S | OCH ₃ | 112-120 |
| 4.76 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CF ₃ | OH | CH ₂ | OH | 3,38 (s); 3,56 (d); 3,79 (d); 8,16 (s); 8,67 (s, br). |

| Nr. | R ¹ | R ² | R ³ | X | R ⁴ | R ⁵ | Y | R ¹⁹ | physikalische Daten Fp. [°C]; ¹ H-NMR [δ in ppm] |
|------|---------------------------------|---------------------------------|----------------|---|-----------------------------------|----------------|-------------------|----------------------------------|---|
| 4.77 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | O-t-C ₄ H ₉ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 130-135 |
| 4.78 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | O-t-C ₄ H ₉ | H | CH ₂ | OH | 1,25 (s); 3,05 (dd); 3,34 (s); 3,45 (dd); 6,17 (m); 8,08 (s). |
| 4.79 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | OCH ₃ | 1,01 (d); 1,28 (d); 3,35 (m); 3,96 (s); 4,99 (m); 8,12 (d); 8,20 (d). |
| 4.80 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | CH ₃ | H | CHCH ₃ | OH | 68-75 |
| 4.81 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OCH ₃ | 1,30 (t); 2,77 (q); 3,25 (dd); 3,34 (s); 3,78 (dd); 3,94 (s); 6,22 (m); 8,24 (s). |
| 4.82 | Cl | SO ₂ CH ₃ | H | O | SC ₂ H ₅ | H | CH ₂ | OH | 65-67 |
| 4.83 | SCH ₃ | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OCH ₂ CH ₃ | 1,28 (t); 2,30 (s); 2,46 (s); 3,28 (t); 4,31 (q); 4,45 (t); 7,42 (d); 7,68 (d). |
| 4.84 | SCH ₃ | SCH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 2,32 (s); 2,48 (s); 3,28 (t); 4,42 (t); 7,48 (d); 7,64 (d); 13,2 (s). |
| 4.85 | SO ₂ CH ₃ | SO ₂ CH ₃ | H | O | H | H | CH ₂ | OH | 3,25 (s); 3,35 (s); 3,44 (t); 8,05 (d); 8,45 (d). |

Die 3-Heterocycly-substituierten Benzoylderivate der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als 5 Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser 10 Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung 15 unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris 20 spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis 25 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot 30 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum 35 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kul- 40 turen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt 45 versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,

Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der 5 erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung 10 von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen 15 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser. 20

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur 25 Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell 30 Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. 35 Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner 40 Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen- 45 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat,

Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder
5 gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-
10 gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat,
15 Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den
20 anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100%
25 (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

30 I. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.2 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure
35 und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

40 II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.9 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctyl-
45 phenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichts-

teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.10 werden in einer
5 Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt
210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungs-
produktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl
besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung
10 in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige
Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.16 werden mit
3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylphtha-
15 linsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer
Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichts-
teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in
einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der
Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine
20 Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.21 werden mit
97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält
auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirk-
25 stoffs enthält.
- VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.22 werden mit
2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure,
8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichts-
30 teilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-
Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen
Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige
Dispersion.
- 35 VII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.34 wird in einer
Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und
10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man
erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 40 VIII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.35 wird in einer
Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und
20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator
auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man
45 erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

150

- Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei
- 5 welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).
- 10 Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).
- 15 Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoylderivate der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt
- 20 und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-
- 25 cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole,
- 30 Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylelessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und
- 35 deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.
- 40 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner
- 45 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von

Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Anwendungsbeispiele

5

Die herbizide Wirkung der 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoyl-derivate der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

- 10 Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- Bei Voraufaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder
15 emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-
20 pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

- Zum Zweck der Nachaufaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm
25 angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.
30 Die Aufwandmenge für die Nachaufaufbehandlung betrug 31,2 bzw. 15,6 g/ha a.S. (aktive Substanz).

- Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte
35 sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

- Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100
40 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

| | Lateinischer Name | Deutscher Name | Englischer Name |
|----|-------------------|-------------------------|-----------------------------|
| 5 | Chenopodium album | Weißer Gänsefuß | lambsquaters (goosefoot) |
| | Setaria faberii | Borstenhirse | giant foxtail |
| | Sinapsis alba | weißer Senf | white mustard |
| 10 | Solanum nigrum | Schwarzer Nachtschatten | black nightshade |
| | Triticum aestivum | Winterweizen | winter wheat |
| | Zea mays | Mais | Indian corn |

Bei Aufwandmengen von 31,2 bzw. 15,6 g/ha zeigte die Verbindung
15 3.33 (Tabelle 3) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die
oben genannten mono- und dicotylen Schadpflanzen und gute Ver-
träglichkeit in Winterweizen und Mais.

20

25

30

35

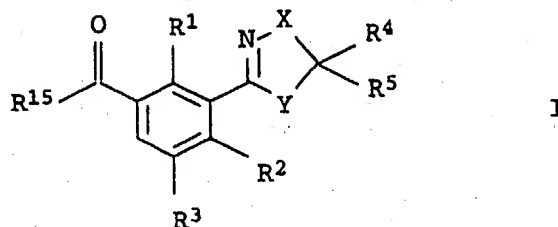
40

45

Patentansprüche

1. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

5



10

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

15

R^1, R^2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl;

20

R^3 Wasserstoff, Halogen oder C_1 - C_6 -Alkyl;

25

R^4, R^5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Di- (C_1 - C_4 -alkoxy)- C_1 - C_4 -alkyl, Di- (C_1 - C_4 -alkyl)-amino- C_1 - C_4 -alkyl, [2,2-Di- (C_1 - C_4 -alkyl)-hydrazino-1]- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkyliminoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Cyanoalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkylcarbonyloxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, Di- (C_1 - C_4 -alkyl)-amino, COR^6 , Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy;

30

35

40

oder

45

R^4 und R^5 bilden gemeinsam eine C_2 - C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1 - C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

oder

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

5

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;

10

R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

15

X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

20

R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;

25

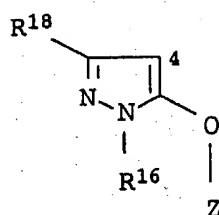
oder

R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

30

R¹⁵ ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II

35



II

40

wobei

45

R¹⁶ C₁-C₆-Alkyl;

155

Z H oder SO_2R^{17} ;

R^{17} C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy;

R^{18} Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl

bedeuten;

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Schwefel stehen;

und

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach Anspruch 1 in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

R^1 , R^2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl;

R^3 Wasserstoff, Halogen oder C_1 - C_6 -Alkyl;

R^4 , R^5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Di-(C_1 - C_4 -alkoxy)- C_1 - C_4 -alkyl, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-amino- C_1 - C_4 -alkyl, [2,2-Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-hydrazino-1]- C_1 - C_4 -alkyl,

156

5 C₁-C₆-Alkyliminoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-
 C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cyclo-
 alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy,
 10 C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogen-
 alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder
 Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten
 partiell oder vollständig halogeniert sein können
 und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen
 können:
 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

oder

15 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die
 ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert
 sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen ge-
 gebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff
 20 unterbrochen sein kann;

oder

25 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff
 eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

R⁶ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy,
 C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder NR⁷R⁸;

30 R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R⁸ C₁-C₄-Alkyl;

35 X O, S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;

Y O, S, NR¹², CO oder CR¹³R¹⁴;

R⁹, R¹² Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

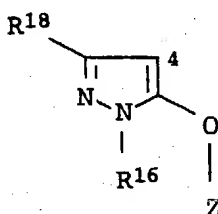
40 R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen-
 alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-
 carbonyl oder CONR⁷R⁸;

45 oder

157

R^4 und R^9 oder R^4 und R^{10} oder R^5 und R^{12} oder R^5 und R^{13} bilden gemeinsam eine C_2-C_6 -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C_1-C_4 -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

R^{15} ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der Formel II



II

wobei

R^{16} C_1-C_6 -Alkyl;

Z H oder SO_2R^{17} ;

R^{17} C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
Nitro, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Halogenalkoxy;

R^{18} Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl

bedeuten;

35 wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel stehen;

und

40 mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,
45 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und

4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

5

3. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach Anspruch 1 oder 2, wobei R³ Wasserstoff bedeutet.

4. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3, wobei

10

R¹, R² Nitro, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl oder C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl;

15

bedeuten.

20

5. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4, wobei Z für SO₂R¹⁷ steht.

25

6. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4, wobei Z für Wasserstoff steht.

7. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6, wobei X für Sauerstoff und Y für CR¹³R¹⁴ stehen.

30

8. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 oder 7, wobei

35

R⁴ Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

40

45

Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

5 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

10

oder

15 R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

bedeuten.

20

9. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 bis 8, wobei

25 R⁴ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl oder CONR⁷R⁸;

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

30

R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

35

oder

40 R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

45 bedeuten.

160

10. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 oder 7, wobei R⁴ und R⁵ für Wasserstoff stehen.
- 5 11. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 oder 7 oder 10, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.
12. 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol.
- 10
13. Landwirtschaftlich brauchbare Salze von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol.
- 15
14. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6, wobei
- 20 X S, NR⁹, CO oder CR¹⁰R¹¹;
- oder
- Y O, S, NR¹² oder CO;
- 25 bedeuten.
15. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 oder 14, wobei R¹⁸ für Wasserstoff steht.
- 30
16. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 4 oder 6 oder 14, wobei
- 35 R⁴ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
- 40 Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, COR⁶, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
- 45 Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

161

R⁵ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

oder

5 R⁴ und R⁵ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

10

oder

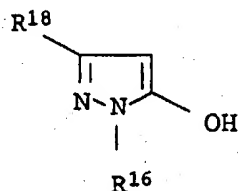
15 R⁴ und R⁹ oder R⁴ und R¹⁰ oder R⁵ und R¹² oder R⁵ und R¹³ bilden gemeinsam eine C₂-C₆-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C₁-C₄-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

20 R¹⁸ C₁-C₆-Alkyl;

bedeuten.

17. Verfahren zur Herstellung von 3-Heterocyclyl-substituierten
25 Benzoylderivaten der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man das Pyrazol der Formel II mit Z = H, wobei die Variablen R¹⁶ und R¹⁸ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

30

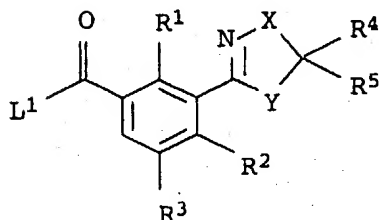


II (mit Z = H)

35

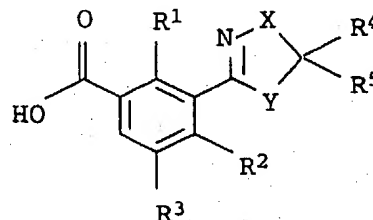
mit einer aktivierten Carbonsäure III α oder mit einer Carbonsäure III β ,

40



III α

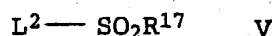
45



III β

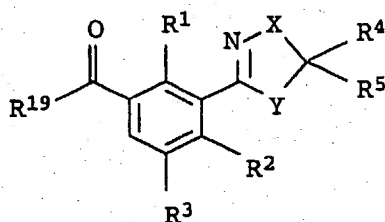
162

wobei die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, zu den Verbindungen I (mit $Z = H$) umlagert und gewünschtenfalls zur Herstellung von 3-Heterocycl-yl-substituierten Benzoyl-derivaten der Formel I mit $Z = SO_2R^{17}$ mit einer Verbindung der Formel V,



wobei R^{17} die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung hat und L^2 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umgesetzt.

18. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel III,



III

wobei R^{19} für Hydroxy oder einen abhydrolysierbaren Rest steht und die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter den Ansprüchen 1 bis 16 genannte Bedeutung haben, mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoessäuremethylester, 2-Chlor-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-4-methylsulfonylbenzoessäuremethylester und 2,4-Dichlor-3-(5-methylcarbonyloxy-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-benzoessäuremethylester.

19. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel III nach Anspruch 18, wobei die Variablen R^1 bis R^5 , X und Y die unter den Ansprüchen 2 bis 16 genannte Bedeutung haben.

20. 3-Heterocycl-yl-substituierte Benzoessäurederivate der Formel III nach den Ansprüchen 18 oder 19, wobei

R^{19} Halogen, Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy

bedeutet.

21. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens
eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivats der
Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes
von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 16, und für die Formulierung
von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.
22. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 21,
dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame
Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoyl-
derivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauch-
baren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 16 und für die
Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel
mischt.
23. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs,
dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame
Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoyl-
derivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauch-
baren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 16, auf
Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.
24. Verwendung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderviate
der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze
gemäß den Ansprüchen 1 bis 16 als Herbizide.

INTERNATIONAL RESEARCH REPORT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inter: Aktenzeichen

PCT/EP 98/00069

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| FR 2316235 A | | CH 601251 A | 30-06-1978 |
| | | DE 2627223 A | 30-12-1976 |
| | | GB 1481161 A | 27-07-1977 |
| | | US 4070536 A | 24-01-1978 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/00069

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| WO 9626206 A | 29-08-1996 | AU 4665596 A | 11-09-1996 |
| | | CA 2210693 A | 29-08-1996 |
| | | EP 0811007 A | 10-12-1997 |
| | | FI 973471 A | 22-08-1997 |
| | | LT 97145 A, B | 26-01-1998 |
| | | NO 973861 A | 22-10-1997 |
| | | PL 322277 A | 19-01-1998 |
| EP 0203428 A | 03-12-1986 | JP 61257974 A | 15-11-1986 |
| | | JP 1902599 C | 08-02-1995 |
| | | JP 6025133 B | 06-04-1994 |
| | | JP 62053971 A | 09-03-1987 |
| | | AU 5735886 A | 13-11-1986 |
| | | CA 1283116 A | 16-04-1991 |
| | | US 4744815 A | 17-05-1988 |
| DE 2513750 A | 09-10-1975 | JP 1001829 C | 19-06-1980 |
| | | JP 50126830 A | 06-10-1975 |
| | | JP 54036648 B | 10-11-1979 |
| | | AU 7934175 A | 23-09-1976 |
| | | CA 1077944 A | 20-05-1980 |
| | | CA 1069329 A | 08-01-1980 |
| | | CA 1075030 A | 08-04-1980 |
| | | FR 2274219 A | 09-01-1976 |
| | | GB 1463473 A | 02-02-1977 |
| | | US 4414392 A | 08-11-1983 |
| | | US 4301293 A | 17-11-1981 |
| | | US 4508910 A | 02-04-1985 |
| | | US 4063925 A | 20-12-1977 |
| | | US 4687858 A | 18-08-1987 |
| | | US 4146726 A | 27-03-1979 |
| | | US 4261729 A | 14-04-1981 |
| FR 2316235 A | 28-01-1977 | JP 1202059 C | 25-04-1984 |
| | | JP 52000265 A | 05-01-1977 |
| | | JP 58035187 B | 01-08-1983 |
| | | JP 1270923 C | 25-06-1985 |
| | | JP 52000266 A | 05-01-1977 |
| | | JP 58035188 B | 01-08-1983 |
| | | BR 7603968 A | 22-03-1977 |

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 261:00)

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie [*] | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------------------|--|--------------------|
| | | |



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

^{*} Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen^{"A"} Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist^{"E"} älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist^{"L"} Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)^{"O"} Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht^{"P"} Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist^{"T"} Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist^{"X"} Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden^{"Y"} Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist^{"&"} Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

15. Mai 1998

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Henry, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte: onales Aktenzeichen

PCT/EP 98/00069

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D413/10 A01N43/72 C07D498/10 C07D417/10 C07D261/04
 C07D291/04 C07D273/00 C07D263/10 C07D261/20 C07D277/10
 C07D277/34 C07D403/10 C07D419/10 //(C07D498/10,311:00,

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| X | WO 96 26206 A (BASF AG) 29.August 1996 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche | 1-24 |
| A | EP 0 203 428 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 3.Dezember 1986 siehe Ansprüche | 1-24 |
| A | DE 25 13 750 A (SANKYO CO) 9.Oktober 1975 siehe Ansprüche | 1-24 |
| A | FR 2 316 235 A (SANKYO CO) 28.Januar 1977 siehe das ganze Dokument | 1-24 |

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

15.Mai 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

26/05/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Henry, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP 98/00069

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| FR 2316235 A | | CH 601251 A | 30-06-1978 |
| | | DE 2627223 A | 30-12-1976 |
| | | GB 1481161 A | 27-07-1977 |
| | | US 4070536 A | 24-01-1978 |
| <hr/> | | | |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP 98/00069

| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 9626206 | A | 29-08-1996 | AU 4665596 A | 11-09-1996 |
| | | | CA 2210693 A | 29-08-1996 |
| | | | EP 0811007 A | 10-12-1997 |
| | | | FI 973471 A | 22-08-1997 |
| | | | LT 97145 A, B | 26-01-1998 |
| | | | NO 973861 A | 22-10-1997 |
| | | | PL 322277 A | 19-01-1998 |
| EP 0203428 | A | 03-12-1986 | JP 61257974 A | 15-11-1986 |
| | | | JP 1902599 C | 08-02-1995 |
| | | | JP 6025133 B | 06-04-1994 |
| | | | JP 62053971 A | 09-03-1987 |
| | | | AU 5735886 A | 13-11-1986 |
| | | | CA 1283116 A | 16-04-1991 |
| | | | US 4744815 A | 17-05-1988 |
| DE 2513750 | A | 09-10-1975 | JP 1001829 C | 19-06-1980 |
| | | | JP 50126830 A | 06-10-1975 |
| | | | JP 54036648 B | 10-11-1979 |
| | | | AU 7934175 A | 23-09-1976 |
| | | | CA 1077944 A | 20-05-1980 |
| | | | CA 1069329 A | 08-01-1980 |
| | | | CA 1075030 A | 08-04-1980 |
| | | | FR 2274219 A | 09-01-1976 |
| | | | GB 1463473 A | 02-02-1977 |
| | | | US 4414392 A | 08-11-1983 |
| | | | US 4301293 A | 17-11-1981 |
| | | | US 4508910 A | 02-04-1985 |
| | | | US 4063925 A | 20-12-1977 |
| | | | US 4687858 A | 18-08-1987 |
| | | | US 4146726 A | 27-03-1979 |
| | | | US 4261729 A | 14-04-1981 |
| FR 2316235 | A | 28-01-1977 | JP 1202059 C | 25-04-1984 |
| | | | JP 52000265 A | 05-01-1977 |
| | | | JP 58035187 B | 01-08-1983 |
| | | | JP 1270923 C | 25-06-1985 |
| | | | JP 52000266 A | 05-01-1977 |
| | | | JP 58035188 B | 01-08-1983 |
| | | | BR 7603968 A | 22-03-1977 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 98/00069

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 261:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category ^a | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------------------|--|-----------------------|
| | | |



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

^a Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 May 1998

Date of mailing of the international search report

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Henry, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

National Application No.

PCT/EP 98/00069

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D413/10 A01N43/72 C07D498/10 C07D417/10 C07D261/04
 C07D291/04 C07D273/00 C07D263/10 C07D261/20 C07D277/10
 C07D277/34 C07D403/10 C07D419/10 //(C07D498/10,311:00,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|----------|--|-----------------------|
| X | WO 96 26206 A (BASF AG) 29 August 1996 cited in the application see claims | 1-24 |
| A | EP 0 203 428 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 3 December 1986 see claims | 1-24 |
| A | DE 25 13 750 A (SANKYO CO) 9 October 1975 see claims | 1-24 |
| A | FR 2 316 235 A (SANKYO CO) 28 January 1977 see the whole document | 1-24 |

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 May 1998

Date of mailing of the international search report

26/05/1998

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Henry, J